

# Document made available under the Patent Cooperation Treaty (PCT)

International application number: PCT/JP05/006887

International filing date: 30 March 2005 (30.03.2005)

Document type: Certified copy of priority document

Document details: Country/Office: JP  
Number: 2004-374007  
Filing date: 24 December 2004 (24.12.2004)

Date of receipt at the International Bureau: 16 June 2005 (16.06.2005)

Remark: Priority document submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b)



World Intellectual Property Organization (WIPO) - Geneva, Switzerland  
Organisation Mondiale de la Propriété Intellectuelle (OMPI) - Genève, Suisse

日 本 国 特 許 庁  
JAPAN PATENT OFFICE

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出 願 年 月 日

Date of Application:

2 0 0 4 年 1 2 月 2 4 日

出 願 番 号

Application Number:

特 願 2 0 0 4 - 3 7 4 0 0 7

パリ条約による外国への出願  
に用いる優先権の主張の基礎  
となる出願の国コードと出願  
番号

The country code and number  
of your priority application,  
to be used for filing abroad  
under the Paris Convention, is

J P 2 0 0 4 - 3 7 4 0 0 7

出 願 人

Applicant(s):

日本曹達株式会社

2 0 0 5 年 6 月 1 日

特許庁長官  
Commissioner,  
Japan Patent Office

小 川



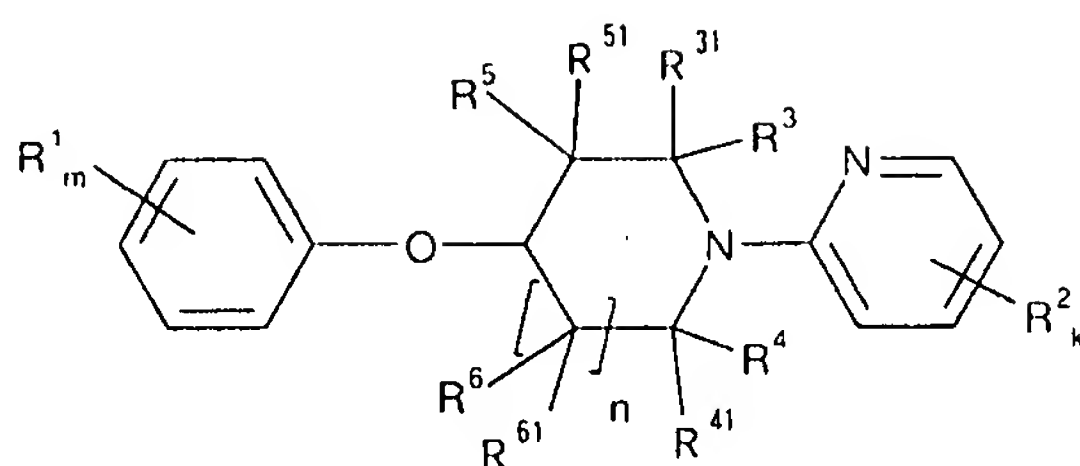
【書類名】 特許願  
【整理番号】 04P00073  
【あて先】 特許庁長官殿  
【発明者】  
    【住所又は居所】 神奈川県小田原市高田3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所  
                                内  
    【氏名】 浜本 伊佐美  
【発明者】  
    【住所又は居所】 神奈川県小田原市高田3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所  
                                内  
    【氏名】 高橋 淳  
【発明者】  
    【住所又は居所】 神奈川県小田原市高田3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所  
                                内  
    【氏名】 矢野 真樹郎  
【発明者】  
    【住所又は居所】 神奈川県小田原市高田3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所  
                                内  
    【氏名】 花井 大輔  
【特許出願人】  
    【識別番号】 000004307  
    【氏名又は名称】 日本曹達株式会社  
【代理人】  
    【識別番号】 100113860  
    【弁理士】  
    【氏名又は名称】 松橋 泰典  
【先の出願に基づく優先権主張】  
    【出願番号】 特願2004-106668  
    【出願日】 平成16年 3月31日  
【手数料の表示】  
    【予納台帳番号】 005256  
    【納付金額】 16,000円  
【提出物件の目録】  
    【物件名】 特許請求の範囲 1  
    【物件名】 明細書 1  
    【物件名】 要約書 1  
    【包括委任状番号】 0303064

【書類名】 特許請求の範囲

【請求項 1】

式 [I]

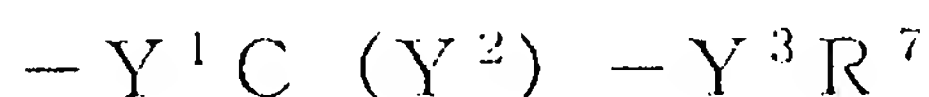
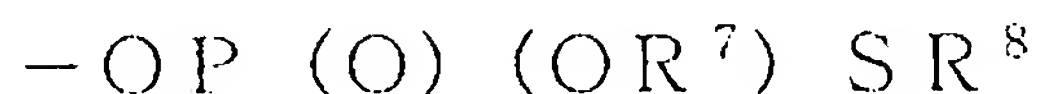
【化 1】



[I]

【式中、 $R^1$ は、ヒドロキシル基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ホルミル基、 $G^1$ で置換されても良い $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{1-6}$ ハロアルキル基、 $C_{1-6}$ ハロアルケニル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $G^2$ で置換されても良い $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{1-6}$ ハロアルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ ハロアルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニルオキシ基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニルオキシ基、 $C_{1-6}$ アルキルチオカルボニルオキシ基、 $G^3$ で置換されても良いアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{1-6}$ ハロアルキルチオ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{1-6}$ ハロアルキルスルフィニル基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{1-6}$ ハロアルキルスルホニル基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、 $C_{1-6}$ ハロアルキルスルホニルオキシ基、または下記式

【化 2】



( $R^7$ および $R^8$ はそれぞれ独立して $C_{1-6}$ アルキル基を表す。 $Y^1$ 、 $Y^2$ 、および $Y^3$ はそれぞれ独立して酸素原子または硫黄原子を表す。)

で表される置換基のいずれかを表し、 $m$ は0または1～5の整数を表す。

$R^2$ は、ハロゲン原子、ニトロ基、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{1-6}$ ハロアルキル基、または $C_{1-6}$ ハロアルコキシ基を表し、 $k$ は0または1～4の整数を表す。

$R^3$ 、 $R^{31}$ 、 $R^4$ 、 $R^{41}$ 、 $R^5$ 、 $R^{51}$ 、 $R^6$ 、および $R^{61}$ は、それぞれ独立して水素原子、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、または $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、 $R^3$ と $R^4$ または $R^5$ と $R^6$ は一緒になって飽和環を形成してもよい。

$G^1$ は、ヒドロキシル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{1-6}$ アルコキシアルコキシ基、または $C_{3-6}$ シクロアルキル基を表す。

$G^2$ は、ヒドロキシル基、シアノ基、 $G^4$ で置換されていても良いアミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{1-6}$ アルコキシアルコキシ基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、またはハロゲン原子もしくは $C_{1-6}$ アルキル基で置換されていても良い $C_{6-10}$ アリール基を表す。

$G^3$ は、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、または $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基を表す。

$G^4$ は $C_{1-6}$ アルキル基、または $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基を表す。

$n$ は0または1を表す。]

で表される化合物、式 [I] で表される化合物の塩およびN-酸化物。

【請求項 2】

請求項 1 記載の化合物を含有する有害生物防除剤。

【書類名】 明細書

【発明の名称】 環状アミン化合物および有害生物防除剤

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規な環状アミン化合物およびそれらを有効成分として含有する有害生物防除剤に関する。

【背景技術】

【0002】

従来より、多数の殺虫剤、殺ダニ剤が使用されているが、その効力が不十分であったり、薬剤抵抗性問題によりその使用が制限されたり、また、植物体に薬害や汚染を生じたり、あるいは人畜魚類などに対する毒性が強かったりすることから、必ずしも満足すべき防除薬剤とは言い難いものが少なくない。従って、かかる欠点の少ない安全に使用できる薬剤の開発が要望されている。

【0003】

本発明化合物と類似した骨格を有する化合物が、特許文献1に抗ウィルス剤として記載されているが、殺ダニ活性を有する旨は記載されてなく、本発明化合物の合成および生物活性についてはこれまで報告されていなかった。

【特許文献1】 欧州特許出願公報第0605031号明細書

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

本発明は、工業的に有利に合成でき効果が確実で安全に使用できる有害生物防除剤となりうる新規化合物を提供することを課題とする。

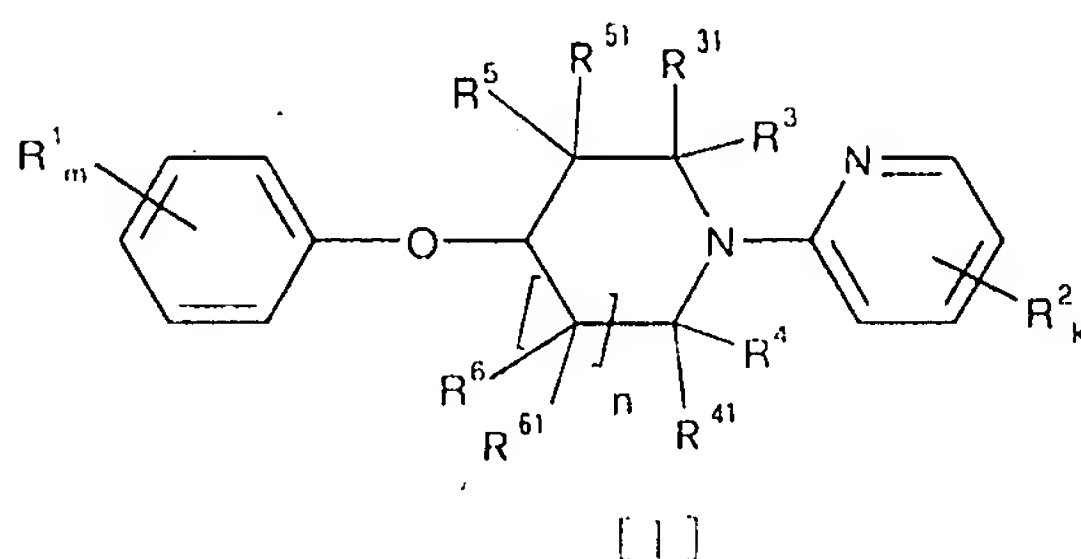
【課題を解決するための手段】

【0005】

本発明は、式【1】

【0006】

【化1】

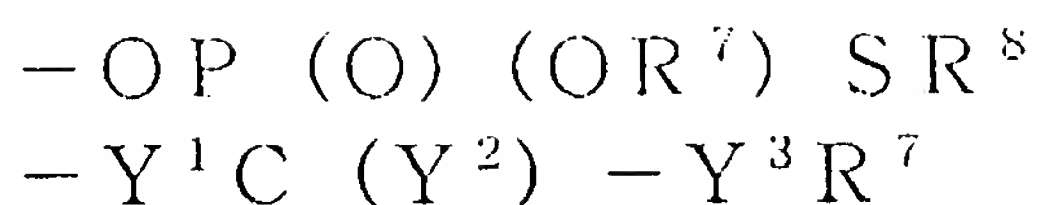


【0007】

【式中、R<sup>1</sup>は、ヒドロキシル基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ホルミル基、G<sup>1</sup>で置換されても良いC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニル基、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル基、C<sub>1-6</sub>ハロアルケニル基、C<sub>1-6</sub>アルキルカルボニル基、G<sup>2</sup>で置換されても良いC<sub>1-6</sub>アルコキシ基、C<sub>1-6</sub>ハロアルコキシ基、C<sub>2-6</sub>アルケニルオキシ基、C<sub>2-6</sub>ハロアルケニルオキシ基、C<sub>2-6</sub>アルキニルオキシ基、C<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>1-6</sub>アルキルカルボニルオキシ基、C<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニルオキシ基、C<sub>1-6</sub>アルキルチオカルボニルオキシ基、G<sup>3</sup>で置換されても良いアミノ基、C<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1-6</sub>ハロアルキルチオ基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1-6</sub>ハロアルキルスルフィニル基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基、C<sub>1-6</sub>ハロアルキルスルホニル基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニルオキシ基、C<sub>1-6</sub>ハロアルキルスルホニルオキシ基、または下記式

【0008】

【化2】



【0009】

( $R^7$ および $R^8$ はそれぞれ独立して $C_{1-6}$ アルキル基を表す。 $Y^1$ 、 $Y^2$ 、および $Y^3$ はそれぞれ独立して酸素原子または硫黄原子を表す。)

で表される置換基のいずれかを表し、 $m$ は0または1～5の整数を表す。

$R^2$ は、ハロゲン原子、ニトロ基、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{1-6}$ ハロアルキル基、または $C_{1-6}$ ハロアルコキシ基を表し、 $k$ は0または1～4の整数を表す。

$R^3$ 、 $R^{31}$ 、 $R^4$ 、 $R^{41}$ 、 $R^5$ 、 $R^{51}$ 、 $R^6$ 、および $R^{61}$ は、それぞれ独立して水素原子、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、または $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、 $R^3$ と $R^4$ または $R^5$ と $R^6$ は一緒になって飽和環を形成してもよい。

$G^1$ は、ヒドロキシル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{1-6}$ アルコキシアルコキシ基、または $C_{3-6}$ シクロアルキル基を表す。

$G^2$ は、ヒドロキシル基、シアノ基、 $G^4$ で置換されていても良いアミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{1-6}$ アルコキシアルコキシ基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、またはハロゲン原子もしくは $C_{1-6}$ アルキル基で置換されていても良い $C_{6-10}$ アリール基を表す。

$G^3$ は、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、または $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基を表す。

$G^4$ は $C_{1-6}$ アルキル基、または $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基を表す。

$n$ は0または1を表す。]

で表される化合物、式【1】で表される化合物の塩およびN-酸化物を有効成分として含有してなる有害生物防除剤である。

【発明を実施するための最良の形態】

【0010】

本明細書中において、ハロゲン原子の例としてフッ素、塩素、臭素、ヨウ素等を挙げる事が出来る。

【0011】

$R^1 \sim R^8$ 、 $R^{31}$ 、 $R^{41}$ 、 $R^{51}$ 、 $R^{61}$ の $C_{1-6}$ アルキル基の例として、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、sec-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、ペンチルおよびその異性体、ヘキシルおよびその異性体等を挙げる事が出来る。

【0012】

$R^1$ の $C_{2-6}$ アルケニル基の例としてエテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル等を挙げる事が出来る。

【0013】

$R^1$ の $C_{2-6}$ アルキニル基の例としてエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-プロピニル、2-メチル-3-ブチニル、1-ペンチニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-2-ブチニル、2-メチル-3-ペンチニル、1-ヘキシニル、1,1-ジメチル-2-ブチニル等を挙げる事が出来る。

【0014】

$R^1$ 、 $R^2$ の $C_{1-6}$ ハロアルキル基の例として、クロロメチル、フルオロメチル、ブロモメチル、ジクロロメチル、ジフルオロメチル、ジブロモメチル、トリクロロメチル、トリ

フルオロメチル、モノブロモジフルオロメチル、トリフルオロエチル、1-クロロエチル、2-クロロエチル、1-ブロモエチル、2-ブロモエチルペンタフルオロエチル等を挙げることが出来る。

【0015】

$R^1$ の $C_{1-6}$ ハロアルケニル基の例として、3-クロロ-2-プロペニル、3, 3-ジクロロ-2-プロペニル、4-クロロ-2-ブテニル、4, 4-ジクロロ-3-ブテニルオキシ、4, 4-ジフルオロ-3-ブテニルオキシ等を挙げることが出来る。

【0016】

$R^1$ 、 $G^3$ 、 $G^4$ の $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基の例として、メチルカルボニル、エチルカルボニル、プロピルカルボニル、ブチルカルボニル等を挙げることが出来る。

【0017】

$R^1 \sim R^8$ 、 $R^{31}$ 、 $R^{41}$ 、 $R^{51}$ 、 $R^{61}$ 、 $G^1$ 、 $G^2$ の $C_{1-6}$ アルコキシ基の例として、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、sec-ブトキシ、イソブトキシ、t-ブトキシ等を挙げることが出来る。

【0018】

$R^1$ 、 $R^{21}$ の $C_{1-6}$ ハロアルコキシ基の例として、クロロメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、トリフルオロメトキシ、1-フルオロエトキシ、1, 1-ジフルオロエトキシ、フルオロエトキシ、1, 1-ジフルオロエトキシ等を挙げることが出来る。

【0019】

$R^1$ の $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基の例として、ビニルオキシ、アリルオキシ、アレニルオキシ、ブテニルオキシ等を挙げることが出来る。

【0020】

$R^1$ の $C_{2-6}$ ハロアルケニルオキシ基の例として、3-クロロ-2-プロペニルオキシ、3, 3-ジクロロ-2-プロペニルオキシ、4-クロロ-2-ブテニルオキシ、4, 4-ジクロロ-3-ブテニルオキシ、4, 4-ジフルオロ-3-ブテニルオキシ等を挙げることが出来る。

【0021】

$R^1$ の $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基の例として、エチニルオキシ、プロパルギルオキシ、2-プロピニルオキシ、2-ブチニルオキシ、1-メチル-2-プロピニルオキシ等を挙げることが出来る。

【0022】

$R^1$ の $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基の例として、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、t-ブトキシカルボニル等の $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基等を挙げることが出来る。

【0023】

$R^1$ の $C_{1-6}$ アルキルカルボニルオキシ基の例として、アセチルオキシ、プロピオニルオキシ、ブチリルオキシ等を挙げることが出来る。

【0024】

$R^1$ 、 $G^2$ の $C_{1-6}$ アルコキシカルボニルオキシ基の例として、メトキシカルボニルオキシ、エトキシカルボニルオキシ等を挙げることが出来る。

【0025】

$R^1$ の $C_{1-6}$ アルキルチオカルボニルオキシ基の例として、メチルチオカルボニルオキシ、エチルチオカルボニルオキシ等を挙げることが出来る。

【0026】

$R^1$ の $C_{1-6}$ アルキルチオ基の例として、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ等を挙げることが出来る。

【0027】

$R^1$ の $C_{1-6}$ ハロアルキルチオ基の例として、モノフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ等を挙げることが出来る。

【0028】



$R^1$ の $C_{1-6}$ アルキルスルフィル基の例として、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル等を挙げることが出来る。

【0029】

$R^1$ の $C_{1-6}$ ハロアルキルスルフィニル基の例として、トリフルオロメチルメチルスルフィニル、ペンタフルオロエチルスルフィニル等を挙げることが出来る。

【0030】

$R^1$ 、 $G^3$ の $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基の例として、メチルスルホニル、エタンスルホニル等を挙げることが出来る。

$R^1$ の $C_{1-6}$ ハロアルキルスルホニル基の例として、トリフルオロメチルスルホニル、ペンタフルオロエチルスルホニル等を挙げることが出来る。

【0031】

$R^1$ の $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基の例として、メチルスルホニルオキシ、エタンスルホニルオキシ等を挙げることが出来る。

【0032】

$R^1$ の $C_{1-6}$ ハロアルキルスルホニルオキシ基の例として、トリフルオロメチルスルホニルオキシ、ペンタフルオロエチルスルホニルオキシ等を挙げることが出来る。

【0033】

$G^1$ 、 $G^2$ の $C_{1-6}$ アルコキシアルコキシ基の例として、メトキシメトキシ、メトキシエトキシ、エトキシメトキシ等を挙げることが出来る。

【0034】

$G^1$ 、 $G^2$ の $C_{3-6}$ シクロアルキル基の例として、シクロプロピル、1-メチルシクロプロピル、2, 2, 3, 3-テトラメチルシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、1-メチルシクロペンチル、シクロヘキシル、1-メチルシクロヘキシル、4-メチルシクロヘキシル等を挙げることが出来る。

【0035】

$G^2$ の $C_{6-10}$ アリール基の例として、フェニル、ナフチル等を挙げることが出来る。

【0036】

式[1]中の $m$ は0または1~5の整数を表し、複数個の $R^1$ を有する場合、同一または互いに異なっていて良い。 $k$ は0または1~4の整数を表し、複数個の $R^2$ を有する場合、同一または互いに異なっていて良い。

【0037】

式中の $R^3$ と $R^4$ または $R^5$ と $R^6$ は一緒になって飽和環を形成してもよい。 $R^3$ と $R^4$ または $R^5$ と $R^6$ は一緒になって飽和環を形成し、全体として、例えば、8-アザビシクロ[3. 2. 1]オクタン環（以下トロパン環と称する）、3-アザビシクロ[3. 2. 1]オクタン環（以下、イソトロパン環と称する）、3-アザビシクロ[3. 3. 1]ノナン等の橋かけ環を形成してもよい。

【0038】

また、本発明化合物[1]のピリジン環の窒素原子やピペリジン環、トロパン環、イソトロパン環等の環状アミン部の窒素原子が酸化された化合物が存在するが、これらのN-酸化物も全て本発明に含まれる。

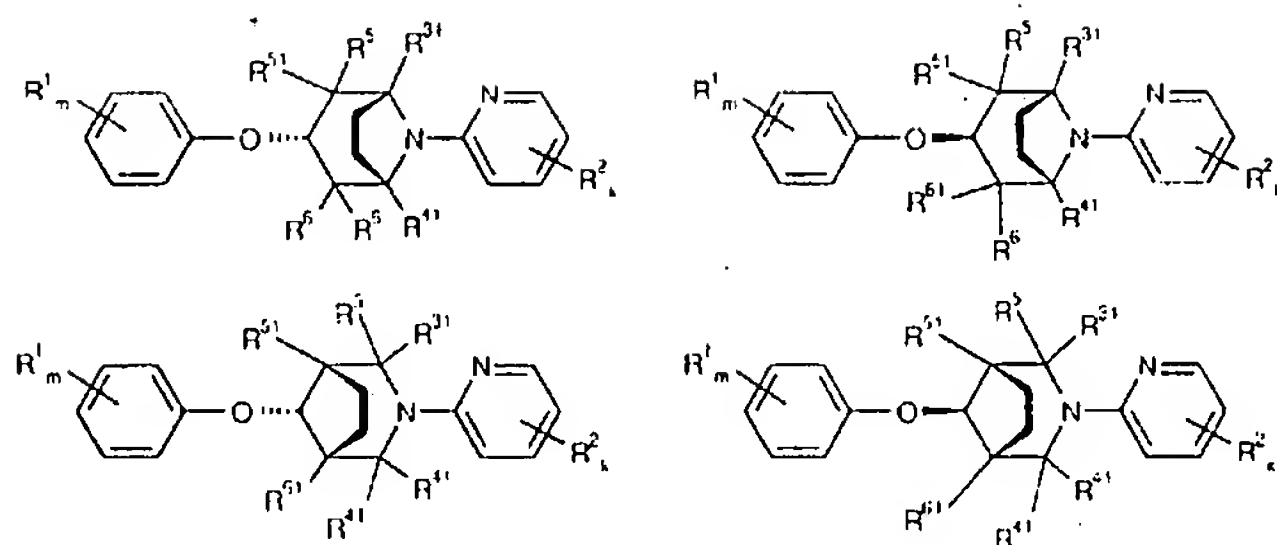
【0039】

本発明化合物[1]の $R^3$ と $R^4$ とが、または $R^5$ と $R^6$ とが一緒になって飽和環を形成する場合、以下の例に示すような2種ずつの異性体が存在する。これらの異性体は全て本発明に含まれる。

【0040】



【化3】

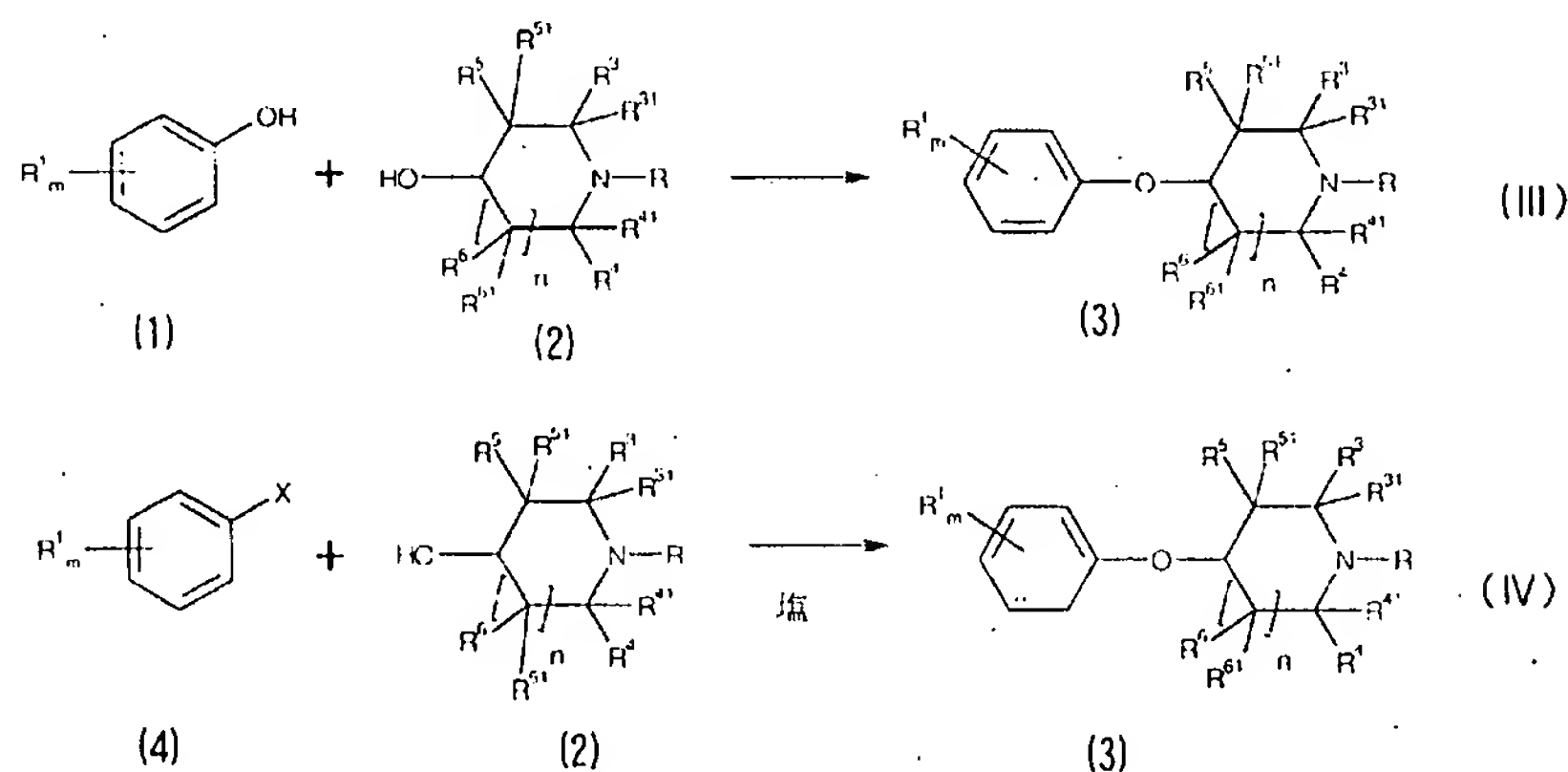


【0041】

本発明化合物の製造法について、以下説明する。

【0042】

【化4】



【0043】

〔式中、 $R^1 \sim R^6$ 、 $R^{31}$ 、 $R^{41}$ 、 $R^{51}$ 、 $R^{61}$ 、 $m$ および $n$ は前記と同じ意味を表し、 $X$ は、脱離基を表す。また、 $R$ は、 $R^{2k}$ で置換された2-ピリジル基、メチル基、ベンジル基のいずれかを表す。〕

【0044】

まず、中間体(3)の製造方法について説明する。

反応式(III)に示すとおり、フェノール(1)と化合物(2)との形式的な脱水反応、例えば、光延反応により、中間体(3)を製造することができる。その具体的な方法については、Tetrahedron Lett., 1978, 2243; J. Org. Chem., 50, 3095 (1985)等に記載されている。なお、フェノール(1)の製造法については、"The Chemistry of Phenols," Eds. Z. Rappoport, J. Wiley (2003), Part 1, pp 395 等に記載されている。

【0045】

また、反応式(IV)に示すとおり、アリアルハライド(4)と化合物(2)とのカップリングによっても中間体3を合成することができる。その具体的な方法については、Synth. Commun., 1984, 14, 621; J. Org. Chem., 48, 3771 (1983); J. Med. Chem., 17, 1000 (1974)等に記載されている。

【0046】

この際、使用できる塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩、ナトリウムメトキシド、カリウム、 $t$ -ブトキシド、マグネシウムエトキシド等の金属アルコキシド、 $n$ -ブチルリチウム、LDA等の有機金属、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属水素化物、トリエ

チルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基等が挙げられる。本反応は溶媒存在下または無溶媒で行うことができる。使用できる溶媒としては、反応に不活性な溶媒であれば特に限定されず、例えばペンタン、ヘキサン、ヘプタン、ベンゼン、トルエン、キシレン等の炭化水素系溶媒、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、アセトニトリル、プロピオンニトリル等のニトリル系溶媒、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル系溶媒、N、N-ジメチルホルムアミド (DMF)、ジメチルスルホキシド (DMSO) 等の非プロトン性極性溶媒、およびこれらの溶媒を二つ以上混合した混合溶媒系が挙げられる。反応温度は $-78^{\circ}\text{C}$ から用いる溶媒の沸点までの温度範囲から任意の温度で反応させることができる。

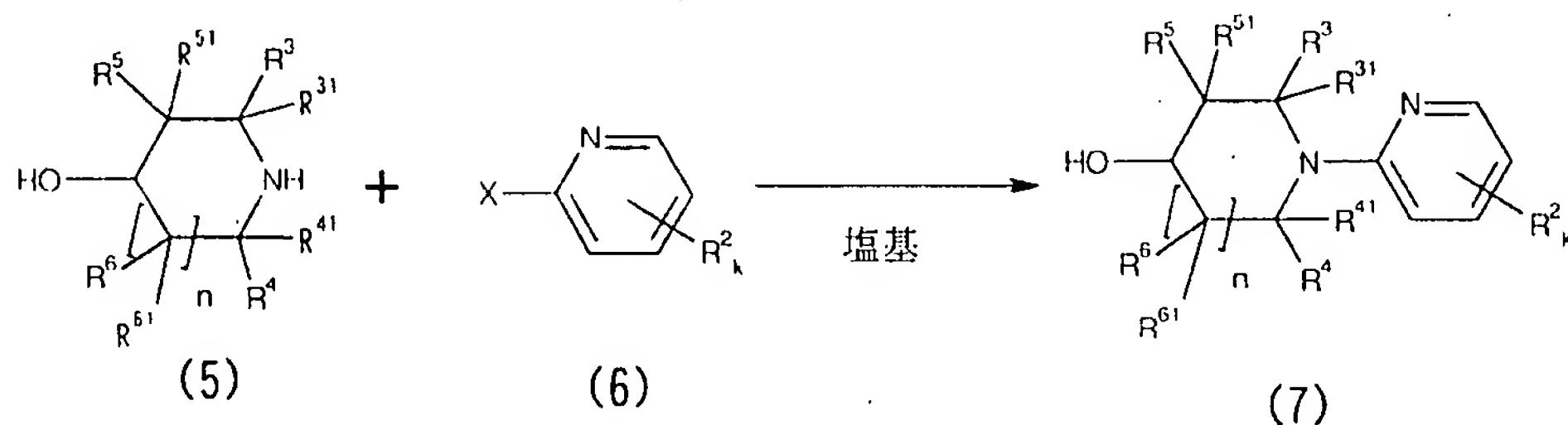
#### 【0047】

化合物 (2) において、Rが、 $R_2$ で置換された2-ピリジル基の場合 (化合物 (7))、反応式 (III) または反応式 (IV) により、直接的に、本発明化合物 [I] を製造できる。

なお、化合物 (7) は、反応式 (V) に示すとおり、アミン 5 と 2-ハロピリジン 6 とのカップリングによって合成することができる。その具体的な方法は、*Synthesis*, 1981, 606; *J. Chem. Soc., C*, 3693 (1971) 等に記載されている。

#### 【0048】

##### 【化5】



#### 【0049】

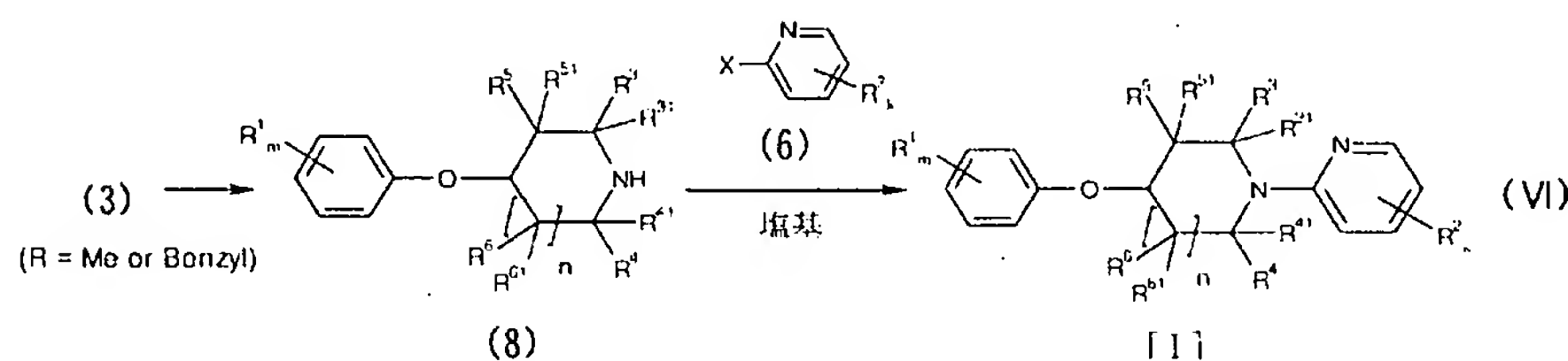
一方、化合物 (2) において、Rが、メチル基またはベンジル基の場合は、反応式 (III) または反応式 (IV) により得られた中間体 (3) から、脱メチル化または脱ベンジル化を行う必要がある。

#### 【0050】

脱メチル化の具体的な方法は、*Tetrahedron Lett.*, 1974, 1325; *ibid.*, 1977, 1565; *ibid.*, 1995, 8867 等に記載されている。また、脱ベンジル化は、通常の接触水素還元などを用いることができる。こうして、反応式 (VI) に示すように、中間体 (3) から、中間体 (8) を得、次いで、2-ハロピリジン (6) とのカップリングによって、本発明化合物 [I] を製造できる。このカップリングの具体的な方法は、反応式 (V) と同様である。

#### 【0051】

##### 【化6】



#### 【0052】

なお、化合物（２）（Rが、メチル基またはベンジル基）は、市販品をそのまま使用できる。また、中間体（８）は、アミンとして単独で、または、塩酸や酢酸などと塩を形成して存在してもよい。

#### 【００５３】

以上の縮合反応終了後は、生成物の精製が必要であれば、蒸留、再結晶またはカラムクロマトグラフィー等の公知慣用の方法により精製することができる。

#### 【００５４】

本発明化合物（式（Ⅰ）で表される化合物、その塩またはN-酸化物）は農業上の有害生物、衛生害虫、貯穀害虫、衣類害虫、家屋害虫等の防除に使用でき、殺成虫、殺若虫、殺幼虫、殺卵作用を有する。その代表例として、下記のものが挙げられる。

鱗翅目害虫、例えば、ハスモンヨトウ、ヨトウガ、タマナヤガ、アオムシ、タマナギンウワバ、コナガ、チャノコカクモンハマキ、チャハマキ、モモシנקイガ、ナシヒメシנקイ、ミカンハモグリガ、チャノホソガ、キンモンホソガ、マイマイガ、チャドクガ、ニカメイガ、コブノメイガ、ヨーロッパアンコーンボーラー、アメリカシロヒトリ、スジマダラメイガ、ヘリオティス属、ヘリコベルバ属、アグロティス属、イガ、コドリリング、ワタアカミムシ等、

半翅目害虫、例えば、モモアカアブラムシ、ワタアブラムシ、ニセダイコンアブラムシ、ムギクビレアブラムシ、ホソヘリカメムシ、アオクサカメムシ、ヤリネカイガラムシ、クワコナカイガラムシ、オンシツコナジラミ、タバココナジラミ、シルバーリーフコナジラミ、ナシキジラミ、ナシグンバイムシ、トビイロウンカ、ヒメトビウンカ、セジロウンカ、ツマグロヨコバイ等、

甲虫目害虫、例えば、キスジノミハムシ、ウリハムシ、コロラドハムシ、イネミズゾウムシ、コクゾウムシ、アズキゾウムシ、マメコガネ、ヒメコガネ、ジアプロティカ属、タバコシバンムシ、ヒラタキクイムシ、マツノマダラカミキリ、ゴマダラカミキリ、アグリオティス属、ニジュウヤホシテントウ、コクヌスト、ワタミゾウムシ等、

双翅目害虫、例えば、イエバエ、オオクロバエ、センチクバエ、ウリミバエ、ミカンコミバエ、タネバエ、イネハモグリバエ、キイロショウジョウバエ、サシバエ、コガタアカイエカ、ネッタイシマカ、シナハマダラカ等、

アザミウマ目害虫、例えば、ミナミキイロアザミウマ、チャノキイロアザミウマ等、

膜翅目害虫、例えば、イエヒメアリ、キイロスズメバチ、カブラハバチ等、

直翅目害虫、例えば、トノサマバッタ、チャバネゴキブリ、ワモンゴキブリ、クロゴキブリ等

シロアリ目害虫、例えば、イエシロアリ、ヤマトシロアリ等、

隠翅目害虫、例えば、ヒトノミ、ネコノミ等、シラミ目害虫、例えば、ヒトジラミ等、

ダニ類、例えば、ナミハダニ、ニセナミハダニ、カンザワハダニ、ミカンハダニ、リンゴハダニ、ミカンサビダニ、リンゴサビダニ、チャノホコリダニ、ブレビバルパス属、エオテトラニカス属、ロビンネダニ、ケナガコナダニ、コナヒョウヒダニ、オウシマダニ、フタトゲチマダニ等、

植物寄生性線虫類、例えば、サツマイモネコブセンチュウ、ネグサレセンチュウ、ダイズシストセンチュウ、イネシンガレセンチュウ、マツノザイセンチュウ等。

#### 【００５５】

適用が好ましい有害生物としては、鱗翅目害虫、半翅目害虫、ダニ類、アザミウマ目害虫、甲虫目害虫であり、特に好ましくは、ダニ類である。

#### 【００５６】

又、近年コナガ、ウンカ、ヨコバイ、アブラムシ等多くの害虫において有機リン剤、カーバメート剤や殺ダニ剤に対する抵抗性が発達し、それら薬剤の効力不足問題を生じており、抵抗性系統の害虫やダニにも有効な薬剤が望まれている。本発明化合物は感受性系統のみならず、有機リン剤、カーバメート剤、ピレスロイド剤抵抗性系統の害虫や、殺ダニ剤抵抗性系統のダニにも優れた殺虫殺ダニ効果を有する薬剤である。

#### 【００５７】

また本発明化合物は薬害が少なく、魚類や温血動物への毒性が低く、安全性の高い薬剤である。

本発明化合物は、水棲生物が船底、魚網等の水中接触物に付着するのを防止するための防汚剤として使用することもできる。

#### 【0058】

本発明化合物の中には、殺菌活性、除草活性、植調作用を示すものもある。また本発明化合物の中間体化合物の中には殺虫・殺ダニ活性を示すものもある。

#### 【0059】

本発明殺虫・殺ダニ剤は本発明化合物の1種又は2種以上を有効成分として含有する。本発明化合物を実際に施用する際には他成分を加えずそのまま使用できるが、通常は、さらに固体担体、液体担体、ガス状担体と混合し、または多孔セラミック板や不織布等の基剤に含浸し、必要により界面活性剤、その他の補助剤を添加して、農薬として使用する目的で一般の農薬のとり得る形態、即ち、水和剤、粒剤、粉剤、乳剤、水溶剤、懸濁剤、顆粒水和剤、フロアブル、エアゾール、煙霧剤、加熱蒸散剤、燻煙剤、毒餌、マイクロカプセル等の形態に製剤化して使用する。

#### 【0060】

添加剤および担体としては固型剤を目的とする場合は、大豆粒、小麦粉等の植物性粉末、珪藻土、燐灰石、石こう、タルク、ベントナイト、パイロフィライト、クレイ等の鉱物性微粉末、安息香酸ソーダ、尿素、芒硝等の有機及び無機化合物が使用される。液体の剤型を目的とする場合は、ケロシン、キシレンおよびソルベントナフサ等の石油留分、シクロヘキサン、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、アルコール、アセトン、メチルイソブチルケトン、鉱物油、植物油、水等を溶剤として使用することができる。噴射剤に用いられるガス状担体としては、ブタンガス、LPG、ジメチルエーテルおよび炭酸ガスを使用することができる。

#### 【0061】

毒餌の基材としては、例えば穀物粉、植物油、糖、結晶セルロース等の餌成分、ジブチルヒドロキシトルエン、ノルジヒドロゲアイアレチック酸等の酸化防止剤、デヒドロ酢酸等の保存料、トウガラシ末等の子供やペットによる誤食防止剤、チーズ香料、タマネギ香料等の害虫誘引性香料を使用することができる。

#### 【0062】

これらの製剤において均一かつ安定な形態をとるために、必要ならば界面活性剤を添加することもできる。界面活性剤としては、特に限定はないが、例えば、ポリオキシエチレンが付加したアルキルエーテル、ポリオキシエチレンが付加した高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したソルビタン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したトリスチリルフェニルエーテル等の非イオン性界面活性剤、ポリオキシエチレンが付加したアルキルフェニルエーテルの硫酸エステル塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ポリカルボン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩のホルムアルデヒド縮合物、イソブチレンー無水マレイン酸の共重合体等が挙げられる。

#### 【0063】

本発明化合物を農業用の有害性物防除剤として使用する場合は、その製剤中の有効成分量は0.01～90重量%であり、とくに好ましくは0.05～85重量%であり、水和剤、乳剤、懸濁剤、フロアブル剤、水溶剤、顆粒水和剤は水で所定の濃度に希釈して、溶解液、懸濁液あるいは乳濁液として、粉剤・粒剤はそのまま植物或いは土壌に散布する方法で使用する。

#### 【0064】

また、本発明化合物を防疫用の有害性物防除剤として使用する場合には、乳剤、水和剤、フロアブル剤等は水で所定の濃度に希釈して施用し、油剤、エアゾール、煙霧剤、毒餌、防ダニシート等についてはそのまま施用する。

#### 【0065】

本発明化合物をウシ、ブタ等の家畜類、イヌ、ネコ等のペット類の動物外部寄生虫防除



用の有害生物防除剤として使用する場合は、通常本発明化合物の製剤を、獣医学的に公知の方法で使用する。その方法としては、例えば全身的抑制（systemic control）を目的とする場合には、錠剤、カプセル、浸漬液、飼料混入、坐薬、注射（筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内等）等により投与する方法が挙げられ、非全身的（non-systemic control）を目的とする場合は、油性又は水性液剤を噴霧、注ぎかけ（pour-on）、滴下（spot-on）等により投与する方法および樹脂製剤を首輪、耳札等の適当な形状に成形した物を装着する方法が挙げられる。この場合、通常宿主動物 1 kg に対して、本発明化合物として 0.01—1000 mg の割合で使用される。

#### 【0066】

なお、本発明化合物は単独でも十分有効であることは言うまでもないが、他の有害生物防除剤、殺菌剤、殺虫・殺ダニ剤、除草剤、植物調節剤、共力剤、肥料、土壌改良剤、動物用飼料等の 1 種又は 2 種以上と混用または併用することもできる。

#### 【0067】

本発明化合物と混用または併用することのできる殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、植物生長調節剤等の有効成分の代表例を以下に示す。

#### 【0068】

殺菌剤：

キャブタン、フォルベット、チウラム、ジラム、ジネブ、マンネブ、マンコゼブ、プロピネブ、ポリカーバメート、クロロタロニン、キントーゼン、キャブタホル、イブロジオン、プロサイミドン、ピンクロゾリン、フルオロイミド、サイモキサニル、メプロニル、フルトラニル、ベンシクロン、オキシカルボキシシン、ホセチルアルミニウム、プロバモカーブ、トリアジメホン、トリアジメノール、プロピコナゾール、ジクロブトラゾール、ピテルタノール、ヘキサコナゾール、マイクロブタニル、フルジラゾール、エタコナゾール、フルオトリマゾール、フルトリアフェン、ベンコナゾール、ジニコナゾール、サイプロコナゾール、フェナリモール、トリフルミゾール、プロクロラズ、イマザリル、ベフラゾエート、トリデモルフ、フェンプロピモルフ、トリホリン、ブチオベート、ピリフェノックス、アニラジン、ポリオキシシン、メタラキシル、オキサジキシル、フララキシル、イソプロチオラン、プロベナゾール、ピロールニトリン、ブラストサイジン S、カスガマイシン、バリダマイシン、硫酸ジヒドロストレプトマイシン、ベノミル、カルベンダジム、チオファネートメチル、ヒメキサゾール、塩基性塩化銅、塩基性硫酸銅、フェンチンアセテート、水酸化トリフェニル錫、ジエトフェンカルブ、メタスルホカルブ、キノメチオナート、ピナバクリル、レシチン、重曹、ジチアノン、ジノカップ、フェナミノスルフ、ジクロメジン、グアザチン、ドジン、IBP、エディフェンホス、メパニピリム、フェルムゾン、トリクラミド、メタスルホカルブ、フルアジナム、エトキノラック、ジメトモルフ、ピロキロン、テクロフタラム、フサライド、フェナジンオキシド、チアベンダゾール、トリシクラゾール、ピンクロゾリン、シモキサニル、シクロブタニル、グアザチン、プロバモカルブ塩酸塩、オキシソリニックス酸。

#### 【0069】

殺虫・殺ダニ剤：

有機燐およびカーバメート系殺虫剤：

フェンチオン、フェントロチオン、ダイアジノン、クロルピリホス、ESP、バミドチオン、フェントエート、ジメトエート、ホルモチオン、マラソン、トリクロルホン、チオメトン、ホスメット、ジクロルボス、アセフェート、EPBP、メチルパラチオン、オキシジメトンメチル、エチオン、サリチオン、シアノホス、イソキサチオン、ピリダフェンチオン、ホサロン、メチダチオン、スルプロホス、クロルフェンビンホス、テトラクロルビンホス、ジメチルビンホス、プロバホス、イソフェンホス、エチルチオメトン、プロフェノホス、ピラクロホス、モノクロトホス、アジンホスメチル、アルディカルブ、メソミル、チオジカルブ、カルボフラン、カルボスルファン、ベンフラカルブ、フラチオカルブ、プロボキスル、BPMC、MTMC、MIPC、カルバリル、ピリミカーブ、エチオフェ

ンカルブ、フェノキシカルブ、カルタップ、チオシクラム、ベンスルタップ等。

#### 【0070】

ピレスロイド系殺虫剤：

ベルメトリン、シベルメトリン、デルタメスリン、フェンバレート、フェンプロバトリン、ピレトリン、アレスリン、テトラメスリン、レスメトリン、ジメスリン、プロバスリン、フェノトリン、プロトリン、フルバリネート、シフルトリン、シハロトリン、フルシトリネート、エトフェンプロックス、シクロプロトリン、トラロメトリン、シラフルオフエン、アクリナトリン等。

#### 【0071】

ベンゾイルウレア系その他の殺虫剤：

ジフルベンズロン、クロルフルアズロン、ヘキサフルムロン、トリフルムロン、テトラベンズロン、フルフェノクスロン、フルシクロクスロン、ブプロフェジン、ピリプロキシフェン、メトブレン、ベンゾエピン、ジアフェンチウロン、イミダクロプリド、フィプロニル、硫酸ニコチン、ロテノン、メタアルデヒド、機械油、BTや昆虫病原ウイルスなどの微生物農薬等。

#### 【0072】

殺線虫剤：

フェナミホス、ホスチアゼート等。

殺ダニ剤：

クロルベンジレート、フェニソプロモレート、ジコホル、アミトラズ、BPPS、ベンゾメート、ヘキシチアゾクス、酸化フェンブタスズ、ポリナクチン、キノメチオネート、CPCBS、テトラジホン、アベルメクチン、ミルベメクチン、クロフェンテジン、シヘキサチン、ピリダベン、フェンピロキシメート、テブフェンピラド、ピリミジフェン、フェノチオカルブ、ジエノクロル等。

#### 【0073】

植物生長調節剤：

ジベレリン類（例えばジベレリンA3、ジベレリンA4、ジベレリンA7）IAA、NAA。

#### 【実施例】

##### 【0074】

次に、実施例を挙げて、本発明をさらに詳細に説明する。実施例中の化合物番号の記載は表1～9のいずれかに記載の番号を示す。

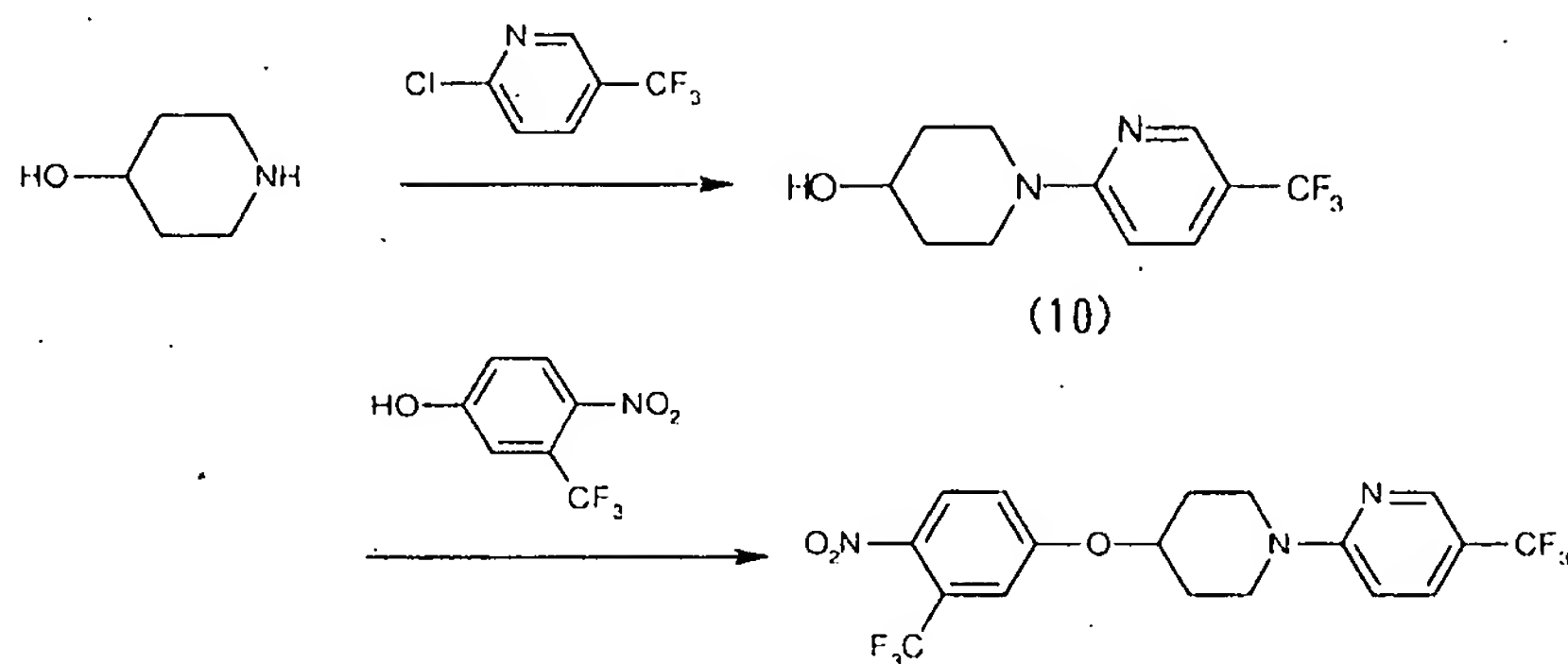
##### 【0075】

製造例1

4-[4-Nitro-3-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-piperidineの製造（化合物番号1-39）

##### 【0076】

【化7】



【0077】

4-ヒドロキシピペリジン (3.0 g)、2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン (5.4 g) のエタノール (25 ml) 溶液に、トリエチルアミン (4.5 g) を加えて、混合物を一晩加熱還流した。混合物を水に注いで、クロロホルムで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、化合物 (10) (5.98 g) を得て、このまま次の反応に用いた。

【0078】

化合物 (10) (4.9 g)、5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾトリフルオリド (3.2 g)、およびトリフェニルホスフィン (5.6 g) の THF (30 ml) 溶液に、水冷下、アゾジカルボン酸ジイソプロピルエステル (4.3 g) の THF (30 ml) 溶液を滴下した。混合物を室温に昇温して3時間攪拌した後、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (5.98 g) を得た。

viscous oil

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.86–1.97 (m, 2H), 2.04–2.14 (m, 2H), 3.64–3.72 (m, 2H), 3.90–3.99 (m, 2H), 4.71–4.77 (m, 1H), 6.70 (d, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.65 (d, 1H), 8.02 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

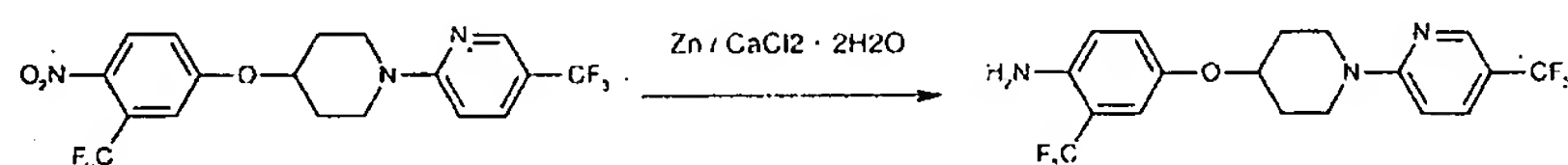
【0079】

製造例 2

4-[4-Amino-3-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-piperidine の製造 (化合物番号 1-168)

【0080】

【化8】



【0081】

製造例 1 で得られたピペリジン (化合物番号 1-39、5.7 g) のエタノール (300 ml) 溶液に、亜鉛末 (18.8 g)、塩化カルシウム 2 水和物 (1.9 g) を加えて、混合物を一晩加熱還流した。混合物を室温まで冷やした後に、セライトを通してろ過し、ろ液を減圧濃縮した。残渣をクロロホルムで希釈、水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、標記化合物 (5.4 g) を得た。

$n_D^{21.6}$  1.5259

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.77–1.88 (m, 2H), 1.94–2.04 (m, 2H), 3.53–3.61 (m, 2H), 3.90–3.99 (m, 3~4H), 4.38–4.45 (m, 1H), 6.69 (t, 2H), 7.00 (d, 1H), 7.04 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

【0082】

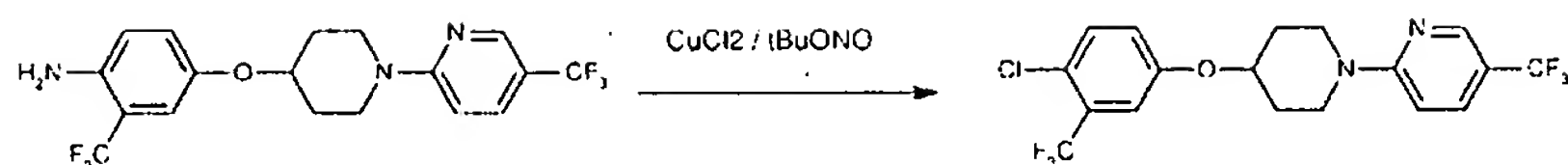
製造例 3

4-[4-Chloro-3-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-piperidine の製造 (化合物番号 1-15)

【0083】



【化 9】



【0084】

塩化銅(II) (0.14 g) のアセトニトリル (5 ml) 懸濁液に、氷冷下、亜硝酸 t-ブチル (0.13 g) を滴下した。混合物を 10 分間攪拌した後に、氷冷下、製造例 2 で得られたピペリジン (化合物番号 1-168、0.35 g) のアセトニトリル (3 ml) 溶液を加えた。混合物を室温に昇温してさらに 1 時間攪拌した。混合物を氷水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (0.2 g) を得た。

$n_D^{21.9} 1.5275$

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.82–1.92 (m, 2H), 1.99–2.08 (m, 2H), 3.60–3.68 (m, 2H), 3.89–3.97 (m, 2H), 4.56–4.63 (m, 1H), 6.69 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 7.24 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

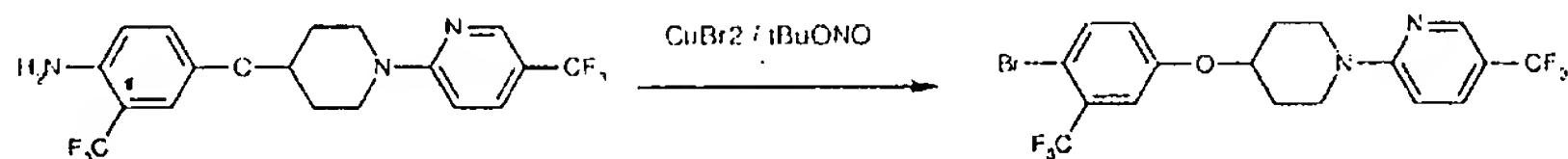
【0085】

製造例 4

4-[4-Bromo-3-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-piperidine の製造 (化合物番号 1-23)

【0086】

【化 10】



【0087】

臭化銅(II) (0.22 g) のアセトニトリル (5 ml) 懸濁液に、氷冷下、亜硝酸 t-ブチル (0.12 g) を滴下した。混合物を 10 分間攪拌した後に、氷冷下、製造例 2 で得られたピペリジン (化合物番号 1-168、0.32 g) のアセトニトリル (2 ml) を加えた。混合物を室温に昇温してさらに 2.5 時間攪拌した。混合物を氷水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (0.21 g) を得た。

$n_D^{21.9} 1.5365$

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.81–1.92 (m, 2H), 1.99–2.08 (m, 2H), 3.60–3.68 (m, 2H), 3.88–3.96 (m, 2H), 4.57–4.63 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.94 (d, 1H), 7.24 (s, 1H), 7.58 (s, 1H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

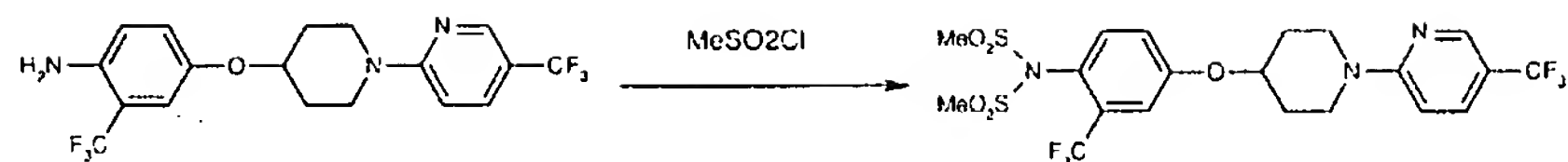
【0088】

製造例 5

4-[4-[Bis(methylsulfonyl)amino]-3-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]piperidine の製造 (化合物番号 1-178)

【0089】

【化 1 1】



【0090】

製造例 2 で得られたピペリジン（化合物番号 1-168、0.32 g）の THF（5 ml）溶液に、氷冷下、メタンスルホニルクロリド（0.09 g）とトリエチルアミン（0.08 g）を加えた。混合物を室温に昇温して 4 時間攪拌し、さらに 3.5 時間加熱還流した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物（0.20 g）を得た。

amorphous

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.87-1.96 (m, 2H), 2.01-2.10 (m, 2H), 3.47 (s, 6H), 3.64-3.73 (m, 2H), 3.88-3.96 (m, 2H), 4.64-4.69 (m, 1H), 6.70 (d, 1H), 7.13 (dd, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.64 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

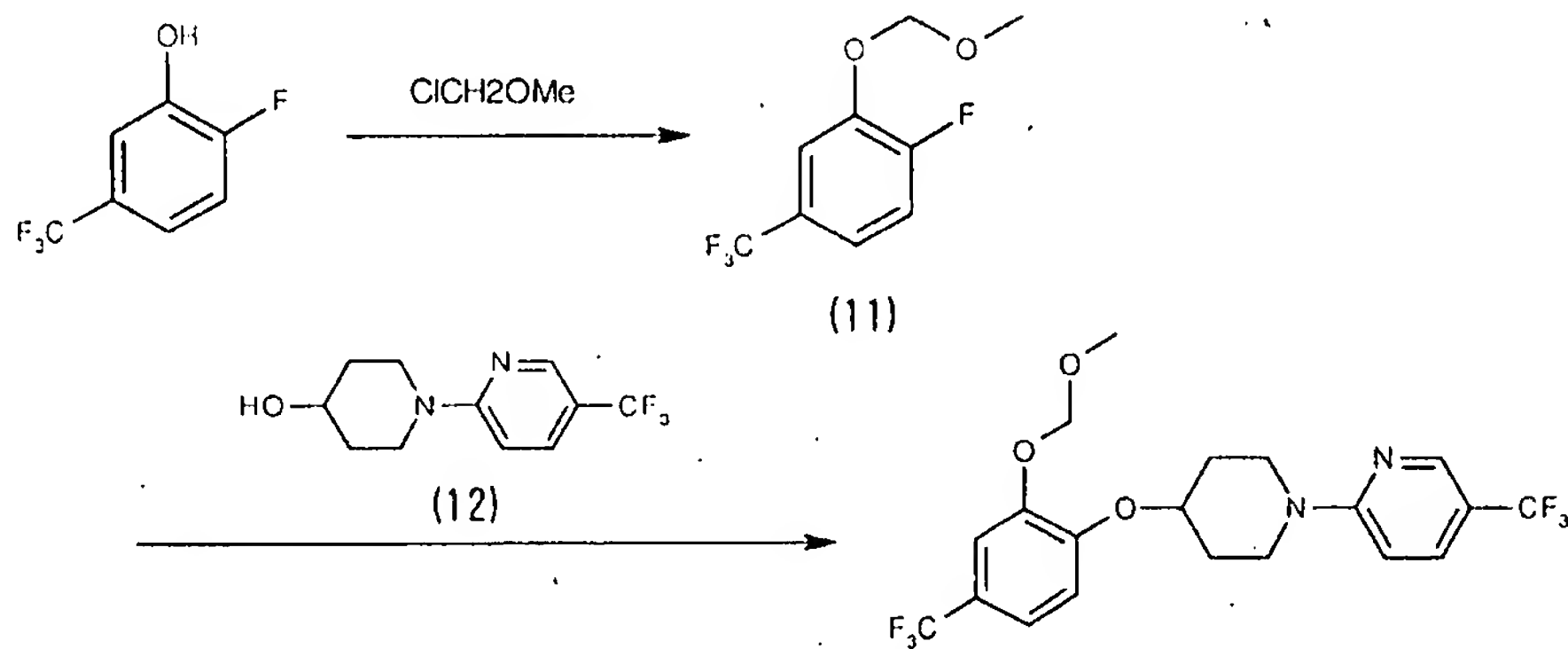
【0091】

製造例 6

4-[2-(Methoxymethoxy)-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]piperidine の製造（化合物番号 1-105）

【0092】

【化 1 2】



【0093】

4-フルオロ-3-ヒドロキシベンゾトリフルオリド（0.36 g）の DMF（5 ml）溶液に、60%水素化ナトリウム（88 mg）を加えて、氷冷下、クロロメチルメチルエーテル（0.24 g）を滴下し、混合物を室温に昇温して 5 時間攪拌した。混合物を水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、粗製の化合物（11）（0.45 g）を得て、このまま次の反応に用いた。

【0094】

ピペリジノール（12）（0.49 g）の DMF（5 ml）溶液に、室温で、60%水素化ナトリウム（90 mg）を加えた。混合物を 10 分間攪拌した後に、ベンゾトリフルオリド（11）の DMF（5 ml）溶液を加えて、約 100℃まで昇温して、一晩攪拌した。混合物を混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラム

クロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (0.56 g) を得た。

$n_D^{23.9} 1.4969$

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.87–1.96 (m, 2H), 2.00–2.08 (m, 2H), 3.53 (s, 3H), 3.56–3.65 (m, 2H), 3.95–4.03 (m, 2H), 4.61–4.65 (m, 1H), 5.21 (s, 2H), 6.69 (d, 1H), 7.02 (d, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.38 (s, 1H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

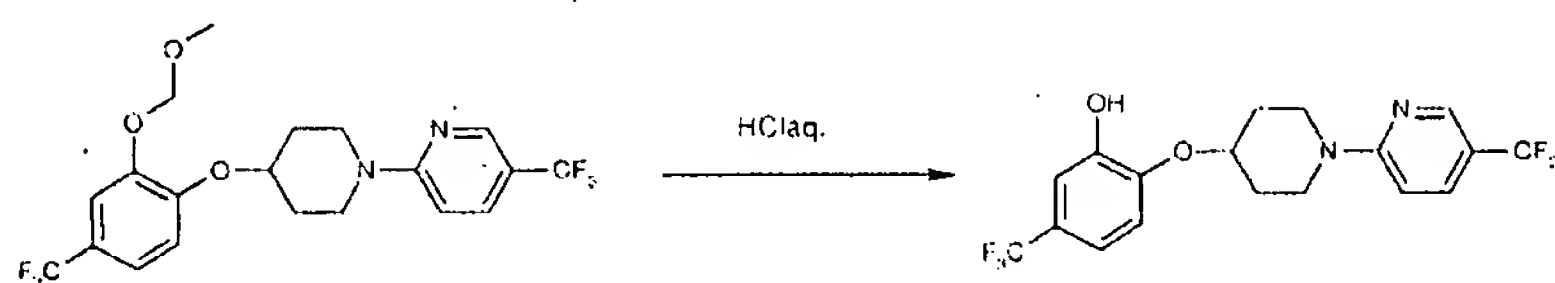
【0095】

製造例 7

4-[2-Hydroxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]piperidine の製造 (化合物番号 1-4)

【0096】

【化13】



【0097】

製造例 6 で得られたピペリジン (化合物番号 1-105、0.38 g) の THF (5 ml) 溶液に、室温で 10% 塩酸水 (5 ml) を加えた。混合物を 2 時間攪拌した後、10% 塩酸水 (5 ml) を加えて、一晩攪拌した。混合物を水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和重曹水、食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、標記化合物 (0.31 g) を得た。

viscous oil

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.85–1.94 (m, 2H), 2.11–2.17 (m, 2H), 3.48–3.57 (m, 2H), 4.02–4.10 (m, 2H), 4.66–4.70 (m, 1H), 5.72 (s, 1H), 6.70 (d, 1H), 6.95 (d, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.65 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

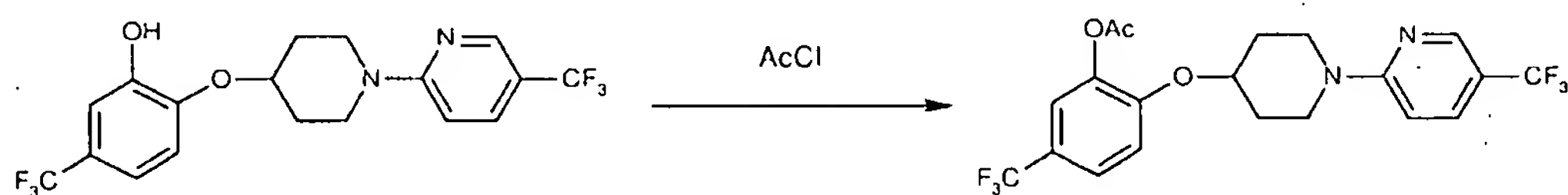
【0098】

製造例 8

4-[2-Acetoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]piperidine の製造 (化合物番号 1-167)

【0099】

【化14】



【0100】

製造例 7 で得られたピペリジン (化合物番号 1-105、0.17 g) とトリエチルアミン (50 mg) のアセトニトリル (5 ml) 溶液に、氷冷下、塩化アセチル (36 mg

)を加えた。混合物を室温に昇温して3時間攪拌した後、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、標記化合物(0.22g)を得た。

mp. 85-95°C

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.88-2.05 (m, 4H), 2.30 (s, 3H), 3.70-3.84 (m, 4H), 4.68-4.70 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 7.33 (s, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

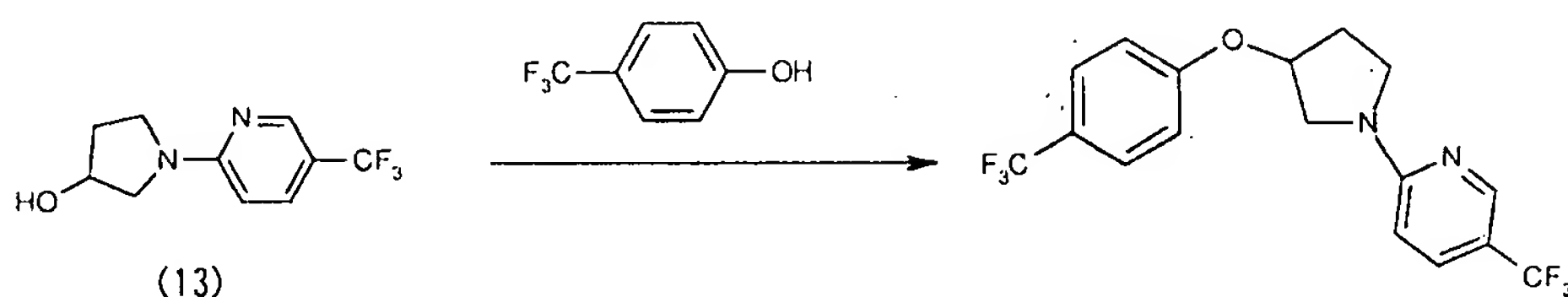
【0101】

製造例9

3-[4-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]pyrrolidineの製造(化合物番号8-63)

【0102】

【化15】



【0103】

ピロリジノール(13)(0.35g)と4-トリフルオロメチルフェノール(0.16g)を用いて、実施例1と同様の方法により、標記化合物(0.32g)を得た。なお、化合物(13)は、製造例1の化合物(10)と同様の方法により調整した。

mp. 109-112°C.

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  2.26-2.46 (m, 2H), 3.62-3.75 (m, 2H), 3.85 (s, 2H), 5.10-5.15 (m, 1H), 6.42 (d, 1H), 6.96 (d, 2H), 7.56 (d, 2H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

【0104】

製造例10

2-Methyl-4-[2-propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]piperidineの製造(化合物番号1-93)

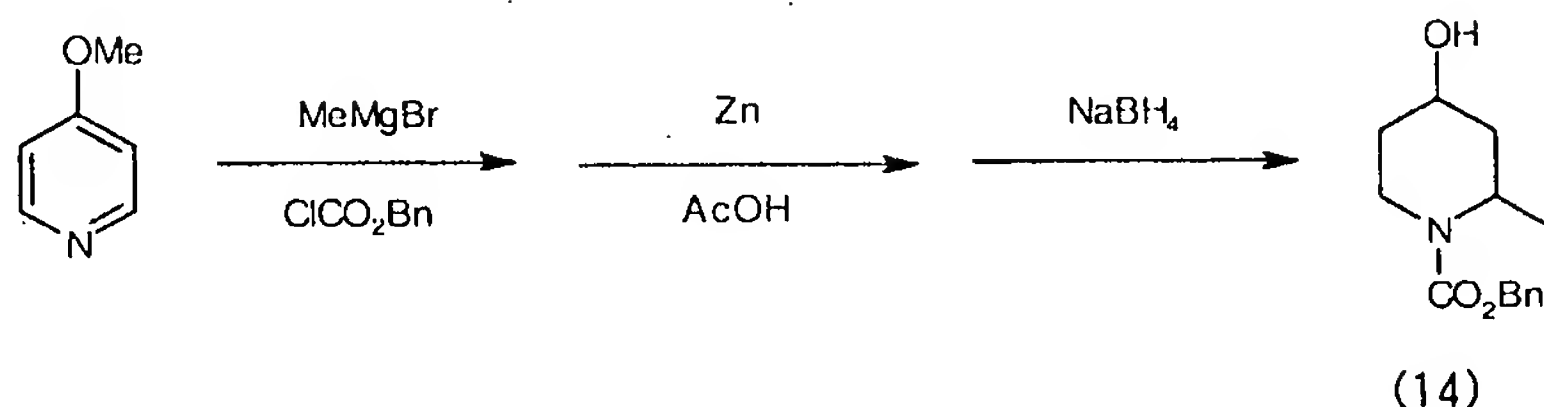
【0105】

工程1

1-Benzylloxycarbonyl-2-methyl-4-piperidinol(14)の製造

【0106】

【化16】



【0107】

以下の反応は、Tetrahedron Lett. 1986, 27, 4549に記載された方法に従った。

4-メトキシピリジン (2.50 g) の THF (25 ml) 溶液に、 $-30^{\circ}\text{C}$  から  $-20^{\circ}\text{C}$  に保ちながら、メチルマグネシウムブロミド (3.0 M エーテル溶液、7.6 ml) を滴下した。混合物を 10 分間攪拌した後、 $-30^{\circ}\text{C}$  から  $-20^{\circ}\text{C}$  に保ち、クロロギ酸ベンジル (3.90 g) を滴下した。混合物を 30 分間攪拌した後、室温まで昇温した。混合物を 10 % 塩酸に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して油状物 (5.34 g) を得て、このまま次の反応に用いた。

#### 【0108】

以下の反応は、J. Org. Chem., 2001, 66, 2181に記載された方法に従った。

この油状物を酢酸 (150 ml) に溶解し、室温で亜鉛 (21.4 g) を加えた。懸濁液を 6 時間加熱還流した。混合物を冷却後、セライトを通してろ過し、ろ液を減圧留去した。残渣に水を加え、水酸化ナトリウムで中和し、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、油状物 (5.01 g) を得た。この油状物 (2.47 g) のエタノール (25 ml) 溶液に、室温で水素化ホウ素ナトリウム (0.38 g) を加え、混合物を 1 時間攪拌した。混合物を減圧濃縮し、水を加えて、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、粗製の化合物 (14) (2.39 g) を得た。

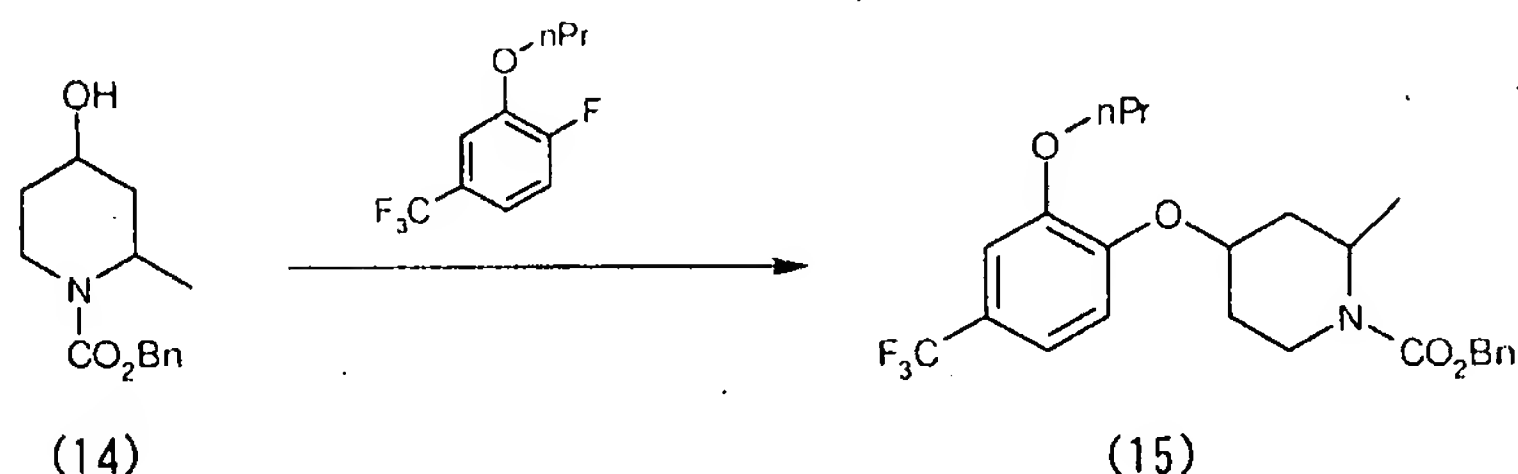
$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.16–1.93 (m, 7H), 2.95–3.37 (m, 1H), 3.88–4.70 (m, 3H), 5.13 (m, 2H), 7.35 (m, 5H)

#### 工程 2

1-Benzylloxycarbonyl-2-Methyl-4-[2-propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]piperidine の製造

#### 【0109】

#### 【化17】



#### 【0110】

化合物 (14) の DMF (25 ml) に、室温で、60 % 水素化ナトリウム (0.42 g) を加えた。混合物を 30 分間攪拌した後、4-フルオロ-3-プロボキシベンゾトリフルオライド (2.13 g) を加え、 $100^{\circ}\text{C}$  に昇温して一晩加熱した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、化合物 (15) (1.02 g) を得た。

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.05 (t, 3H), 1.26 (m, 3H), 1.50–2.04 (m, 6H), 3.00–3.40 (m, 1H), 3.92–4.16 (m, 3H), 4.50–4.73 (m, 2H), 5.15 (m, 2H), 6.93 (m, 1H), 7.10 (m, 2H), 7.33 (m, 5H)

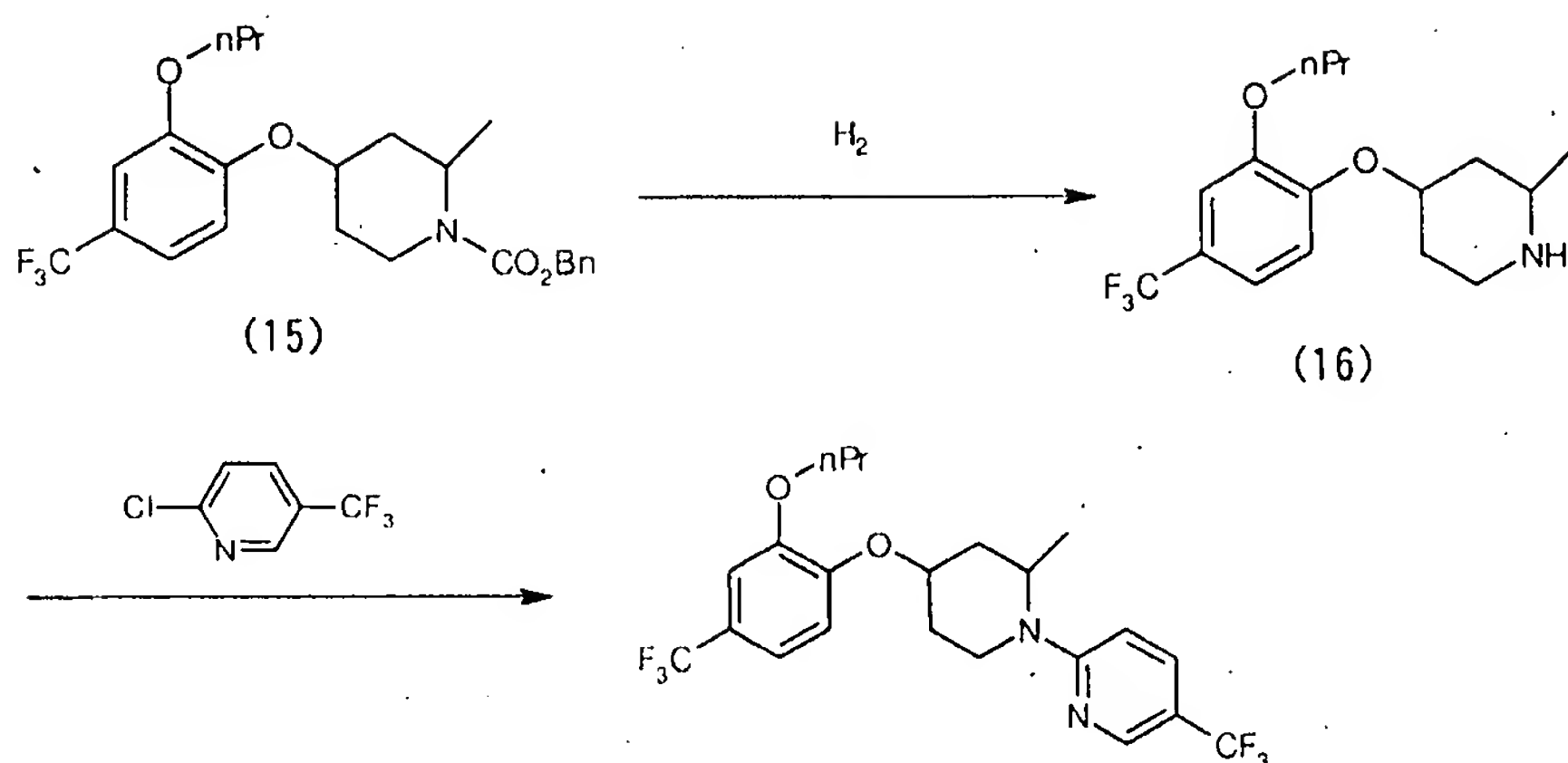
#### 【0111】

### 工程 3

2-Methyl-4-[2-propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]piperidineの製造

【0112】

【化18】



【0113】

化合物(15)のエタノール(25ml)溶液に、5%パラジウム-炭素(0.20g)を加えた。この懸濁液を水素雰囲気下、80℃で8時間加熱した。混合物を冷却後、セライトを通してろ過した。ろ液を減圧留去して、粗製の化合物(16)(0.70g)を得た。

このピペリジンのアセトニトリル(15ml)溶液に、2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン(4.0g)と炭酸カリウム(1.53g)を加え、混合物を3日間加熱還流した。混合物を冷却後、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(30mg)を得た。

viscous oil

$^1H$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.04 (t, 3H), 1.23 (d, 3H), 1.71-1.97 (m, 4H), 2.10-2.26 (m, 2H), 3.05 (m, 1H), 3.98 (t, 2H), 4.43 (m, 1H), 4.63 (m, 1H), 4.88 (m, 1H), 6.61 (d, 1H), 7.00-7.26 (m, 3H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

【0114】

製造例 11

3 $\alpha$ -[2-Methoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-8-azabicyclo[3.2.1]octaneの製造(化合物番号2-77)

【0115】

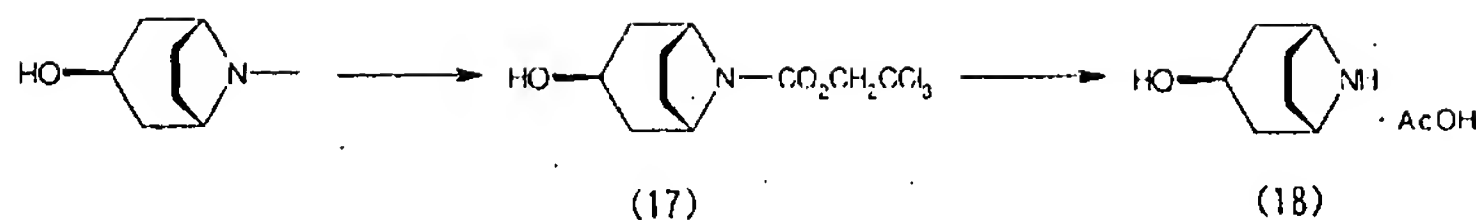
工程 1

3 $\alpha$ -hydroxy-8-azabicyclo[3.2.1]octane, acetic acid salt (18)の製造

【0116】



【化19】



【0117】

トロピン (14.1 g)、炭酸カリウム (1.4 g) のベンゼン (150 ml) 懸濁液に、クロロギ酸 2, 2, 2-トリクロロエチルエステル (23.3 g) を室温に加え、混合物を 3.5 時間加熱還流した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、油状のカーボネート (17) を得て (30.08 g)、そのまま次の反応に用いた。このカーボネート (17) の酢酸 (250 ml) 溶液に、亜鉛末 (65 g) を加えた。混合物を 5 分間攪拌した後に、80℃で 1 時間加熱した。混合物を室温まで冷やした後に、セライトを通してろ過した。ろ液を減圧留去して、粗製の化合物 (18) を得た (15.5 g)。

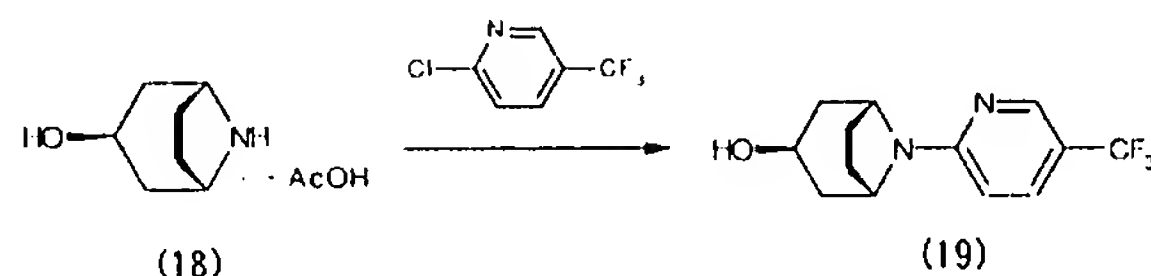
【0118】

工程 2

3α-hydroxy-8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-8-azabicyclo[3.2.1]octane (19) の製造

【0119】

【化20】



【0120】

粗製の化合物 (5.64 g)、炭酸カリウム (41.5 g) および 2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン (8.2 g) のアセトニトリル (150 ml) 懸濁液を 3.5 時間加熱還流した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、結晶として化合物 (19) を得た (3.5 g)。

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.42 (d, 1H), 1.77 (d, 2H), 2.05–2.20 (m, 4H), 2.32–2.39 (m, 2H), 4.09 (brs, 1H), 4.53 (brs, 2H), 6.52 (d, 1H), 7.58 (dd, 1H), 8.38 (d, 1H)

【0121】

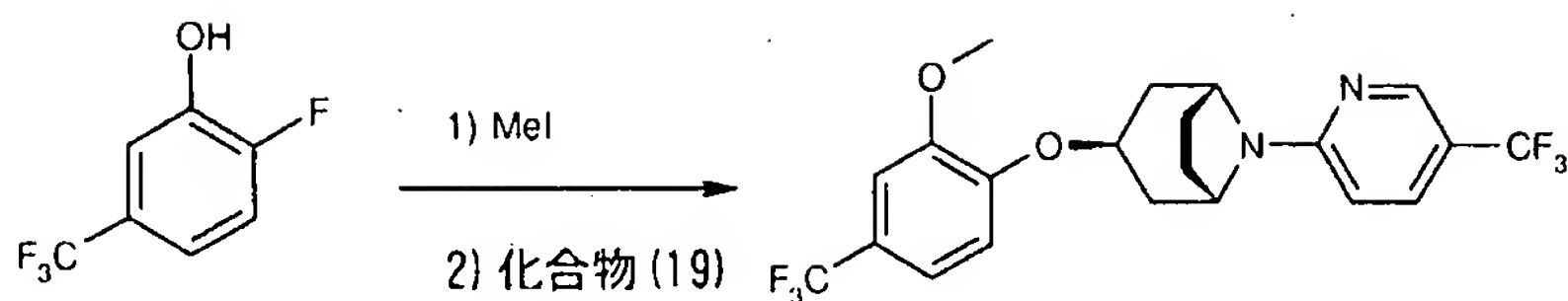
工程 3

3α-[2-Methoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-8-azabicyclo[3.2.1]octane の製造

【0122】



【化 2 1】



【0 1 2 3】

4-フルオロ-3-ヒドロキシベンゾトリフルオリド (0.17 g) の DMF (3 ml) 溶液に、氷冷下、60%水素化ナトリウム (35 mg) を加えた。混合物を 20 分間攪拌した後、ヨードメタン (0.11 g) を加えて、60℃に昇温して 40 分間攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、化合物 (19) (0.22 g) と 60%水素化ナトリウム (35 mg) を室温で加え、100℃で一晩加熱した。混合物を室温まで冷やした後に、氷水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (0.18 g) を得た。

viscous oil

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 2.00–2.22 (m, 6H), 2.38–2.44 (m, 2H), 3.90 (s, 3H), 4.56–4.61 (m, 3H), 6.56 (d, 1H), 6.77 (d, 1H), 7.10 (s, 1H), 7.16 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 8.40 (br d, 1H)

【0 1 2 4】

製造例 12 ~

3α-[2-Propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-8-azabicyclo[3.2.1]octane の製造 (化合物番号 2-82)

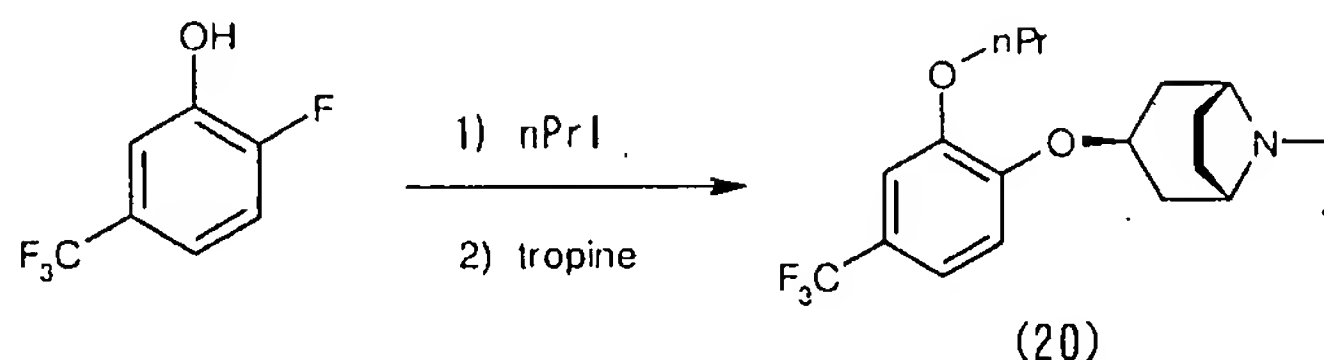
【0 1 2 5】

工程 1

8-Methyl-3α-[2-propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-azabicyclo[3.2.1]octane (20) の製造

【0 1 2 6】

【化 2 2】



【0 1 2 7】

4-フルオロ-3-ヒドロキシベンゾトリフルオリド (1.8 g) の DMF (15 ml) 溶液に、氷冷下、60%水素化ナトリウム (0.44 g) を加えた。混合物を 20 分間攪拌した後、1-ヨードプロパン (1.7 g) の DMF (3 ml) 溶液を加えて、さらに 4 時間攪拌した。混合物にトロピン (1.42 g) と 60%水素化ナトリウム (0.43 g) を室温で加え、100℃に昇温して一晩攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、氷水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、油状の化合物 (20) (1.1 g) を得た。

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.08 (t, 3H), 1.83 (q, 2H), 1.90–2.20 (m, 8H), 2.30 (s, 3H), 3.10–3.11 (m, 2H), 3.95 (t, 2H), 4.58 (t, 1H), 6.79 (d, 1H), 7.05 (s, 1H), 7.13 (d, 1H)

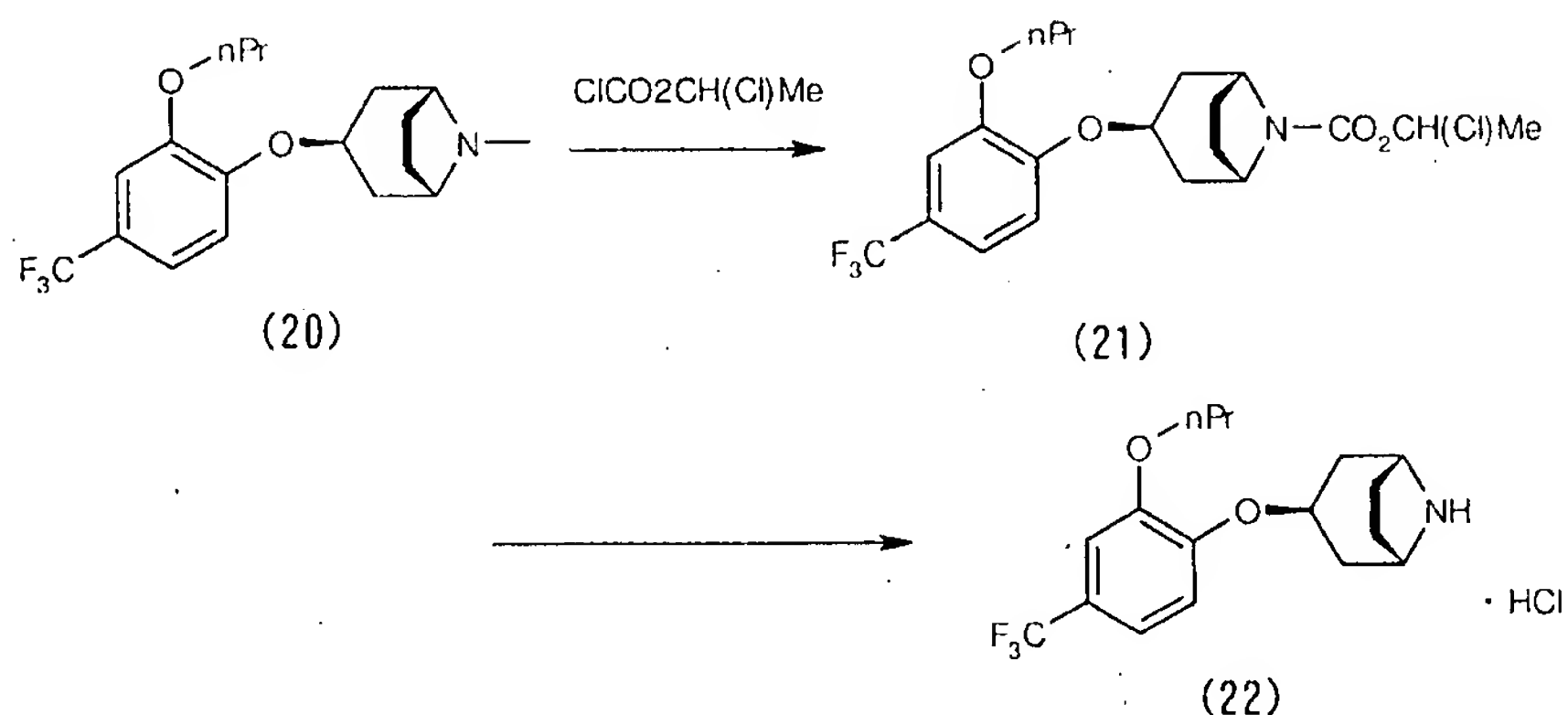
【0128】

工程2

3 $\alpha$ -[2-propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-azabicyclo[3.2.1]octane, hydrochloric acid salt (22) の製造

【0129】

【化23】



【0130】

化合物(20) (1.0 g) の塩化メチレン (6 ml) 溶液に、室温で、クロロギ酸 1-クロロエチルエステル (0.83 g) の塩化メチレン (4 ml) 溶液を加えて、混合物を一晩加熱還流した。混合物を塩化メチレンで希釈し、飽和重曹水、食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、粗製のカーバネート (21) を得て、このまま次の反応に用いた。

【0131】

化合物(21) にメタノール (6 ml) を加えて、2.5 時間加熱還流した。混合物を減圧濃縮して、粗製の (22) を得て、このまま次の反応に用いた。

$^1\text{H}$  NMR of the salt-free (22) (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.10 (t, 3H), 1.61 (brs, 1H), 1.70–1.92 (m, 4H), 2.01–2.09 (m, 4H), 2.20–2.31 (m, 2H), 3.52 (brs, 2H), 3.95 (t, 2H), 4.63–4.65 (m, 1H), 6.78 (d, 1H), 7.06 (s, 1H), 7.15 (d, 1H)

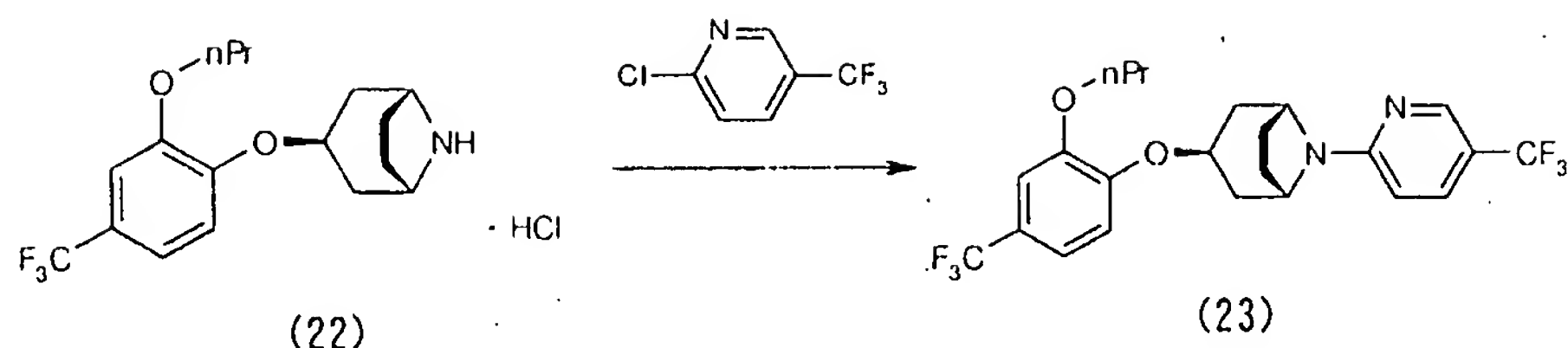
【0132】

工程3

3 $\alpha$ -[2-Propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-8-azabicyclo[3.2.1]octane の製造

【0133】

【化24】



【0134】

粗製の(22)、トリエチルアミン(1.18g)、および2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン(0.53g)のエタノール(10ml)溶液を一晩加熱還流した。混合物に、トリエチルアミン(3g)、2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン(1.6g)およびエタノール(10ml)を加えて、さらに、一晩加熱還流した。混合物を室温まで冷やした後に、氷水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(0.31g)を得た。

mp. 90-92℃

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.09 (t, 3H), 1.82-1.93 (m, 2H), 2.01-2.23 (m, 6H), 2.43-2.50 (m, 2H), 3.97 (t, 2H), 4.56-4.62 (m, 3H), 6.55 (d, 1H), 6.77 (d, 1H), 7.08 (s, 1H), 7.15 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

【0135】

製造例13

8β-[2-Propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-3-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-3-azabicyclo[3.2.1]octaneの製造(化合物番号5-97)

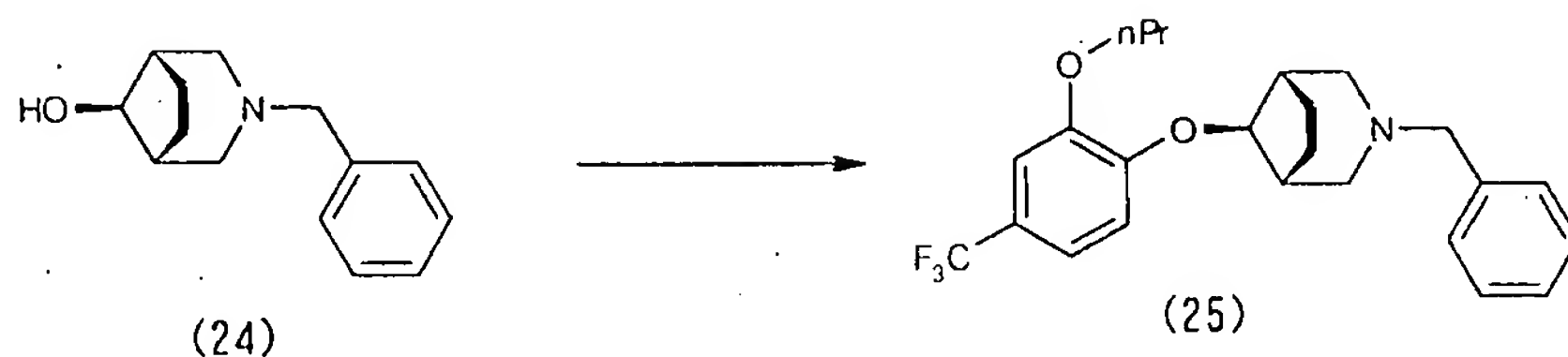
【0136】

工程1

N-Benzyl-8β-[2-Propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-3-azabicyclo[3.2.1]octane (24)の製造

【0137】

【化25】



【0138】

N-Benzyl-3-azabicyclo[3.2.1]octane-8β-ol (24)は、J. Med. Chem. 2003, 46, 1456-1464に記載された方法で合成した。

【0139】

4-フルオロ-3-ヒドロキシベンゾトリフルオリド(0.50g)のDMF(4ml)溶液に、氷冷下、60%水素化ナトリウム(0.12g)を加えた。混合物を室温下30分間攪拌した後、1-ヨードプロパン(0.51g)を加えた。混合物を90℃に昇温

して30分間攪拌した。混合物に(24)(0.41g)のDMF(4ml)溶液と60%水素化ナトリウム(0.09g)を室温に加え、15分間攪拌した後、100℃に昇温して2時間攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、油状の(25)(0.75g)を得た。

<sup>1</sup>H NMR(CDC13) δ 1.05(t, 3H), 1.75-1.91(m, 6H), 2.19(d, 2H), 2.34(b r s, 2H), 2.74(d, 2H), 3.51(s, 2H), 3.96(t, 2H), 4.33(s, 1H), 6.94(d, 1H), 7.07(s, 1H), 7.13(d, 1H), 7.20-7.34(m, 5H),

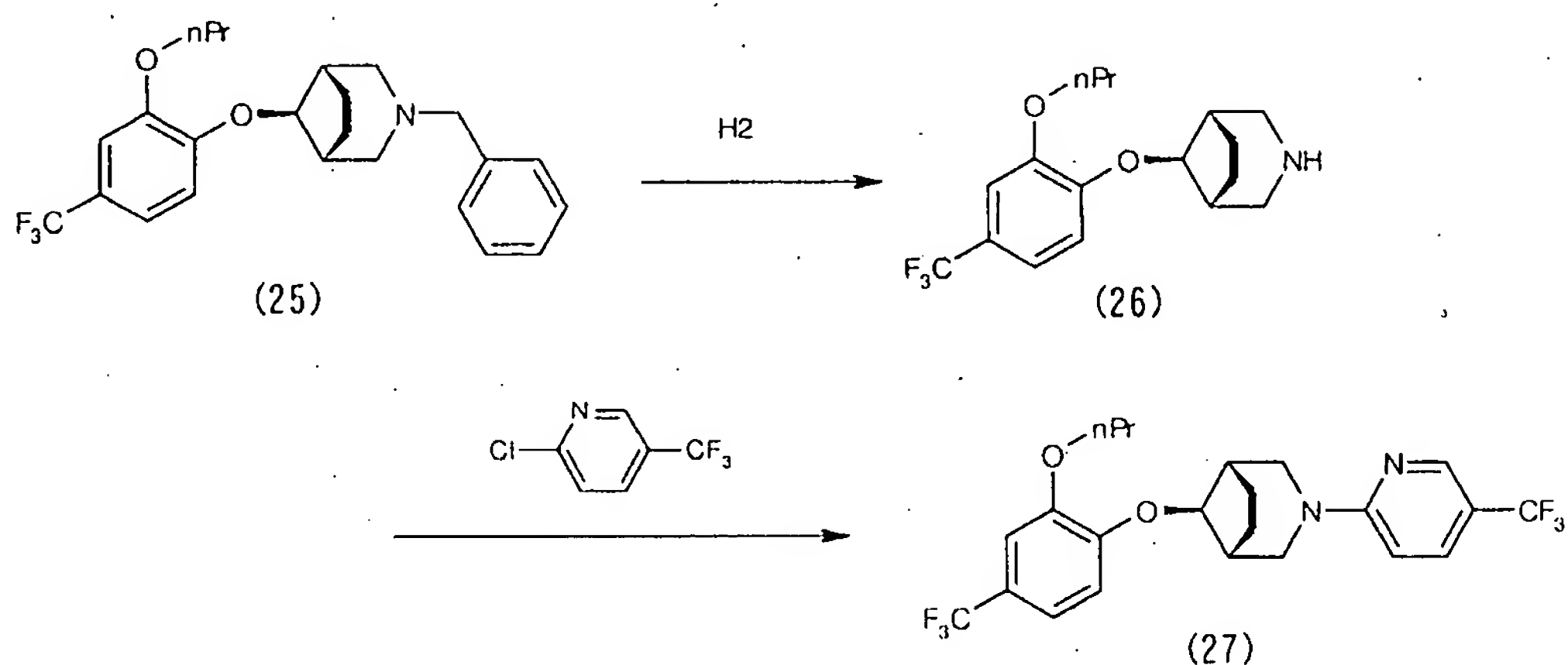
【0140】

工程2

8β-[2-Propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-3-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-3-azabicyclo[3.2.1]octaneの製造

【0141】

【化26】



【0142】

化合物(25)(0.66g)のエタノール(20ml)溶液に、10%パラジウム-炭素(0.13g)を加えた。この懸濁液を水素雰囲気下、室温で一晩攪拌した。混合物をセライトを通してろ過し、ろ液を減圧留去して、粗製の化合物(26)(0.55g)を得た。

【0143】

粗製の化合物(26)(0.55g)のアセトニトリル(12ml)溶液に、2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン(0.57g)と炭酸カリウム(0.66g)を加え、混合物を22時間加熱還流した。混合物を冷却後、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(0.26g)を得た。

mp. 48-50℃

<sup>1</sup>H NMR(CDC13) δ 1.06(t, 3H), 1.57-1.63(m, 2H), 1.85(sext, 2H), 2.03-2.06(m, 2H), 2.57(b r s, 2H), 3.08(d, 2H), 3.98(t, 2H), 4.15(d, 2H), 4.63(s, 1H), 6.60(d, 1H), 7.01(d, 1H), 7.11(s, 1H), 7.18(d, 1H), 7.62(d, 1H), 8.39(s, 1H)

【0144】

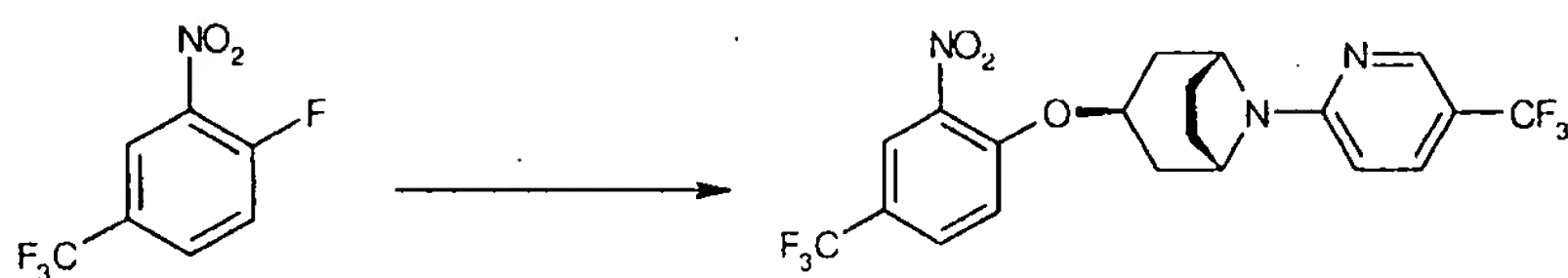
製造例14

3α-[2-Nitro-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-

8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-8-azabicyclo[3.2.1]octaneの製造(化合物番号2-35)

【0145】

【化27】



(19)

【0146】

製造例11、工程2で得られた化合物(19)(5g)のDMF(50ml)溶液に、氷冷下、60%水素化ナトリウム(0.81g)を加えた。混合物を室温で30分間撹拌した後、4-フルオロ-3-ニトロベンゾトリフルオリド(3.84g)を加えた。混合物を室温で1時間撹拌した後、100℃に昇温して一晩撹拌した。混合物を室温まで冷やした後、氷水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(4.95g)を得た。

viscous oil

$^1\text{H}$  NMR(CDC13)  $\delta$  2.01-2.36(m, 8H), 4.59(brs, 2H), 4.75(t, 1H), 6.58(d, 1H), 7.01(d, 1H), 7.63(d, 1H), 7.76(d, 1H), 8.12(s, 1H), 8.40(s, 1H)

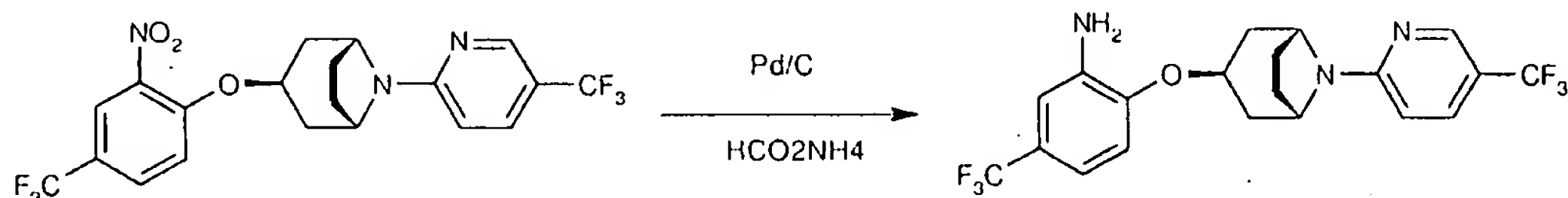
【0147】

実施例15

3 $\alpha$ -[2-Amino-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-8-azabicyclo[3.2.1]octaneの製造(化合物番号2-158)

【0148】

【化28】



【0149】

実施例14で得られた化合物番号2-35(2.14g)のメタノール(24ml)溶液に、10%パラジウム-炭素(0.21g)とギ酸アンモニウム(1.43g)を加えた。混合物を室温で1時間撹拌した。混合物をセライトを通してろ過し、ろ液を減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(1.86g)を得た。

mp. 87-91℃

$^1\text{H}$  NMR(CDC13)  $\delta$  2.03-2.30(m, 8H), 3.95(s, 2H), 4.59-4.64(m, 3H), 6.56(d, 1H), 6.62(d, 1H), 6.94(s, 1H), 6.96(s, 1H), 7.62(d, 1H), 8.41(s, 1H)

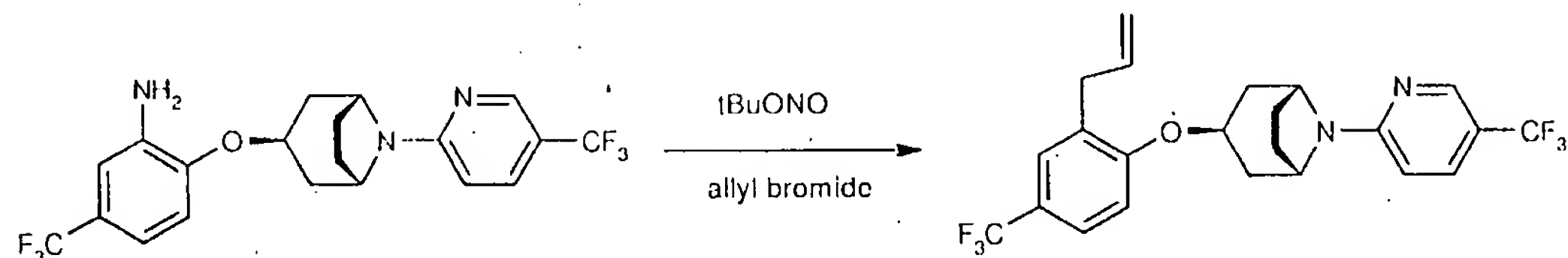
【0150】

製造例16

3-α-[2-Allyl-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-8-azabicyclo[3.2.1]octaneの製造(化合物番号2-62)

【0151】

【化29】



【0152】

以下の反応は、J. Org. Chem., 2002, 67, 6376-6381に記載された方法に従った。

窒素雰囲気下、亜硝酸t-ブチル(0.18g)、臭化アリル(2.1g)のアセトニトリル(7.5ml)溶液に、室温で、実施例15で得られた化合物番号2-158(0.5g)を少量ずつ加えた。混合物を室温で3時間攪拌した後、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(76mg)を得た。

viscous oil

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.99-2.33 (m, 8H), 3.46 (d, 2H), 4.58 (brs, 3H), 5.08-5.15 (m, 2H), 5.94-6.07 (m, 1H), 6.57 (d, 1H), 6.69 (d, 1H), 7.42 (brs, 2H)

7.62 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

【0153】

実施例17

9-β-[2-Methoxymethoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-3-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-3-azabicyclo[3.3.1]nonaneの製造(化合物番号7-100)

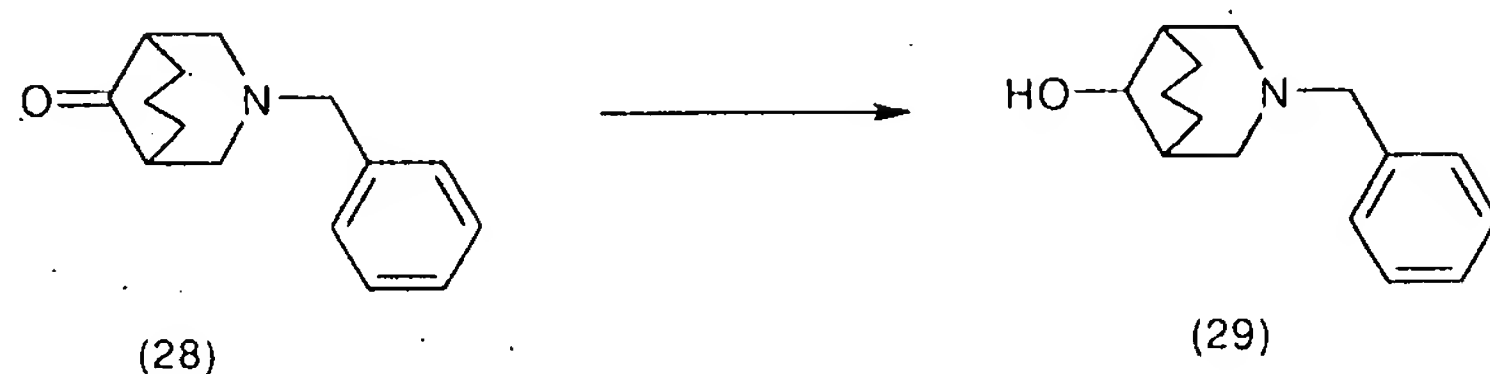
【0154】

工程1

N-Benzyl-3-azabicyclo[3.3.1]nonan-9-ol(化合物21)の製造

【0155】

【化30】



【0156】

N-Benzyl-3-azabicyclo[3.3.1]nonan-9-one(28)は、J. Med. Chem. 1994, 37, 2831-2840に記載され

た方法で合成した。(28) (6.75 g) の MeOH (80 ml) 溶液に、氷冷下、水素化ホウ素ナトリウム (1.49 g) を加えた。混合物を氷冷下 1 時間攪拌した後、溶媒を減圧留去した。残渣に水を加えて、塩化メチレンで抽出し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、粗製の (29) (6.52 g) を得た。

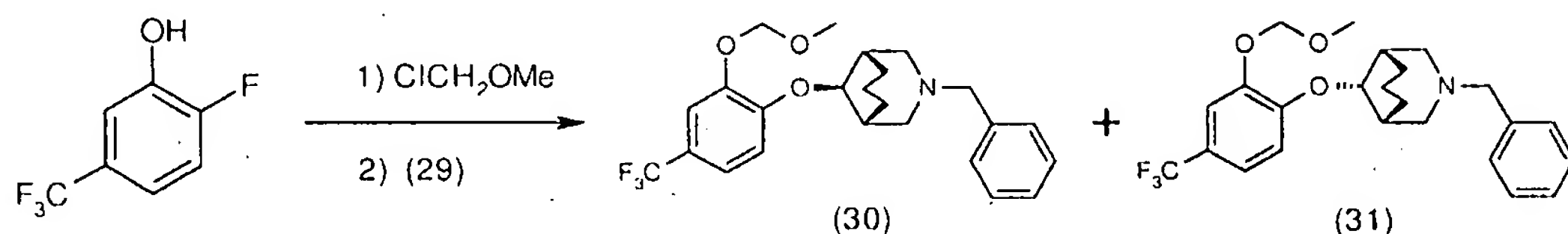
【0157】

## 工程 2

9-[2-Methoxymethoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-3-benzyl-3-azabicyclo[3.3.1]nonane (29), (30) の製造

【0158】

【化31】



【0159】

4-フルオロ-3-ヒドロキシベンゾトリフルオリド (7.49 g) の DMF (75 ml) 溶液に、氷冷下、60% 水素化ナトリウム (1.77 g) を加えた。混合物を室温下 30 分間攪拌した後、氷冷下、クロロメチルメチルエーテル (3.57 g) を滴下した。混合物を室温に昇温して 30 分間攪拌し、さらに 80℃ に昇温して 30 分間攪拌した。混合物に化合物 (29) (6.4 g) と 60% 水素化ナトリウム (1.33 g) を室温で加え、30 分間攪拌した後、100℃ に昇温して 3 時間攪拌した。混合物を室温まで冷やした後、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、化合物 (30) (6.3 g) と化合物 (31) (4.25 g) を得た。

(0.56 g) を得た。

化合物 (30): viscous oil

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.43-1.60 (m, 3H), 2.01-2.08 (m, 4H), 2.36 (d, 2H), 2.65-2.80 (m, 1H), 3.02 (d, 2H), 3.42 (s, 2H), 3.53 (s, 3H), 4.35 (br s, 1H), 5.23 (s, 2H), 6.93 (d, 1H), 7.21-7.33 (m, 8H)

化合物 (31): viscous oil.

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.46-1.55 (m, 1H), 1.68-1.80 (m, 2H), 1.91-1.97 (m, 2H), 2.09 (br d, 3H), 2.68-2.82 (s plus m, 5H), 3.41 (s, 2H), 3.54 (s, 3H), 4.31 (t, 1H), 5.22 (s, 2H), 6.92 (d, 1H), 7.20-7.33 (m, 8H)

【0160】

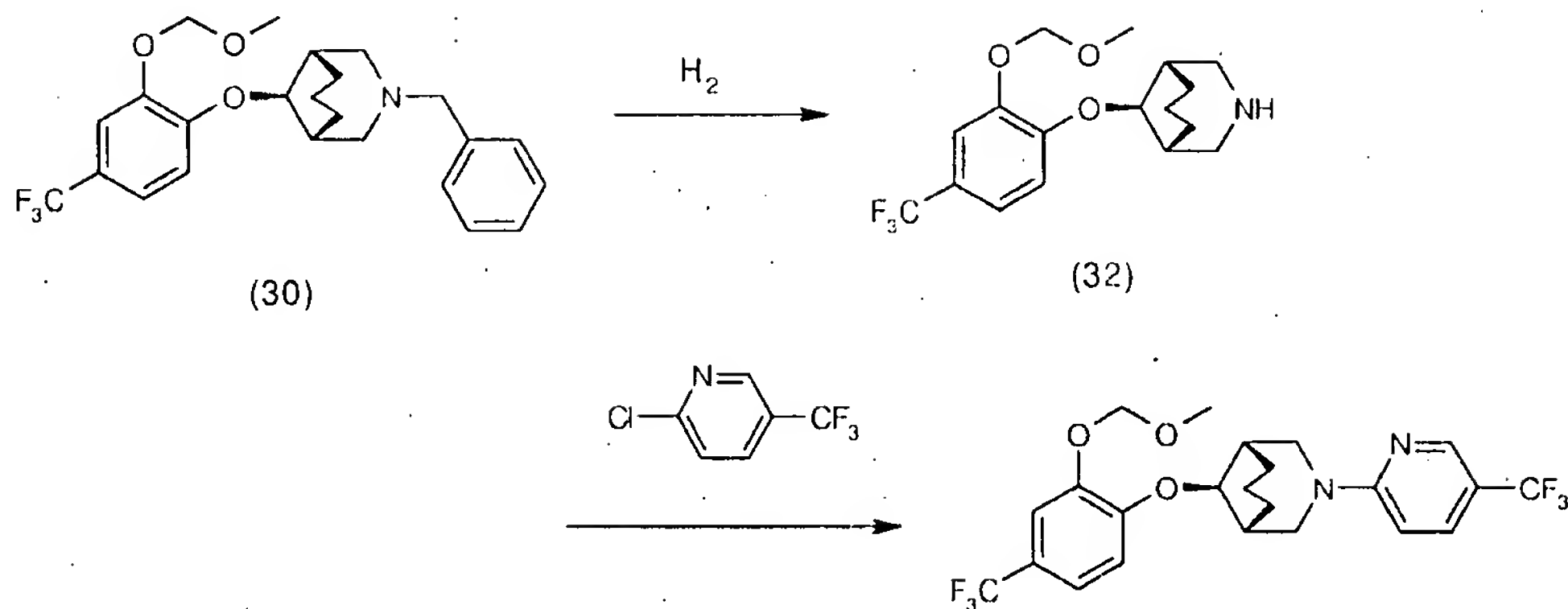
## 工程 3

9β-[2-Methoxymethoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-3-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-3-azabicyclo[3.3.1]nonane の製造

【0161】



【化32】



【0162】

化合物(30)(6.11g)のエタノール(180ml)溶液に、10%パラジウム-炭素(1.22g)を加えた。この懸濁液を水素雰囲気下、室温で1時間、さらに80℃に昇温して7時間攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、セライトを通してろ過し、ろ液を減圧留去して、粗製の(32)(4.54g)を得た。

【0163】

粗製の化合物(32)(4.54g)のアセトニトリル(180ml)溶液に、2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン(11.92g)と炭酸カリウム(10.9g)を加え、混合物を一晩加熱還流した。混合物を冷却後、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(2.61g)を得た。

viscous oil

$^1H$  NMR(CDC13)  $\delta$  1.44-1.69(m, 3H), 1.74-1.91(m, 1H), 2.08-2.21(m, 2H), 2.32(b r s, 2H), 3.28(d, 2H), 3.54(s, 3H), 4.47(d, 2H), 4.62(t, 1H), 5.25(s, 2H), 6.66(d, 1H), 7.02(d, 1H), 7.25(d, 1H), 7.37(s, 1H), 7.63(dd, 1H), 8.42(s, 1H)

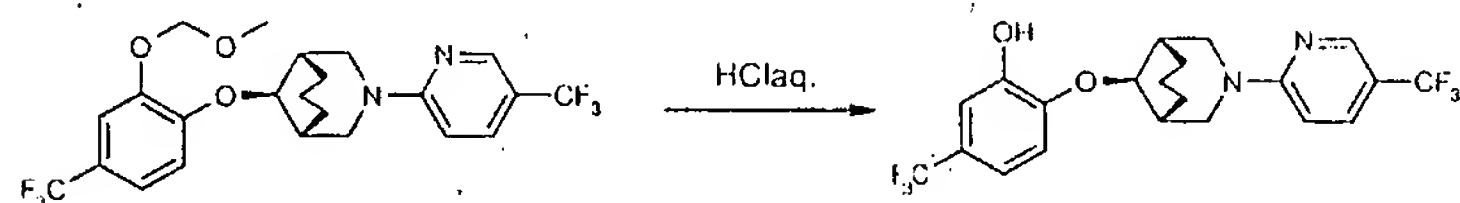
【0164】

実施例18

9 $\beta$ -[2-Hydroxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-3-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-3-azabicyclo[3.3.1]nonaneの製造(化合物番号7-4)

【0165】

【化33】



【0166】

製造例17で得られた(化合物番号7-100)(2.54g)を用いて、実施例7と同様の方法により、標記化合物(2.12g)を得た

mp. 108-110℃

$^1H$  NMR(CDC13)  $\delta$  1.46-1.54(m, 1H), 1.71-1.78(m, 2H), 1.82-1.93(m, 1H), 1.98-2.07(m, 2H), 2.37(b r s, 2H), 3.31(d, 2H), 4.51(d, 2H), 4.70(t,

1 H),

5.81 (s, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.94 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 7.15-7.29 (m, 1H), 7.65 (dd, 1H), 8.43 (s, 1H)

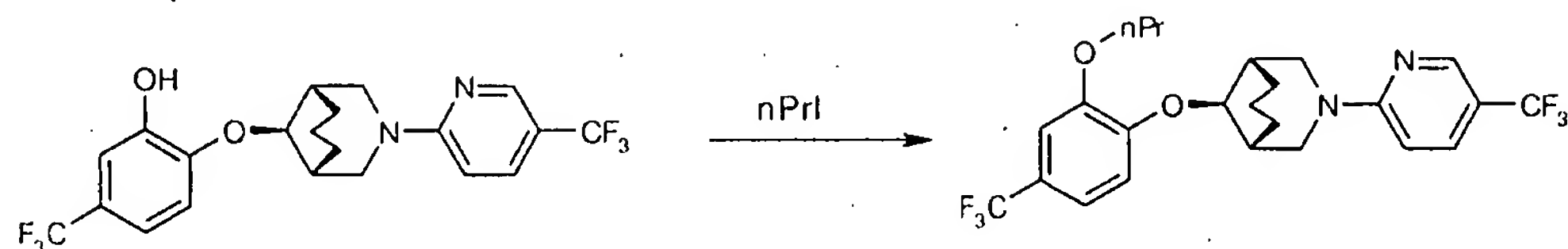
【0167】

製造例19

9β-[2-Propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-3-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-3-azabicyclo[3.3.1]nonaneの製造(化合物番号7-82)

【0168】

【化34】



【0169】

実施例18で得られた(化合物番号7-4)(0.3g)のDMF(15ml)溶液に、水冷下、60%水素化ナトリウム(0.03g)を加えた。混合物を室温下30分間攪拌した後、水冷下、1-ヨードプロパン(0.13g)を加えて、室温下30分間攪拌した。混合物を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(0.27g)を得た。

viscous oil

<sup>1</sup>H NMR(CDC13) δ 1.09 (t, 3H), 1.45-1.49 (m, 3H), 1.55-1.93 (m, 3H), 2.16-2.30 (m, 4H), 3.25 (d, 2H), 4.00 (t, 2H), 4.45 (d, 2H), 4.61 (s, 1H), 6.65 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 7.12-7.24 (m, 2H), 7.63 (dd, 1H), 8.42 (s, 1H).

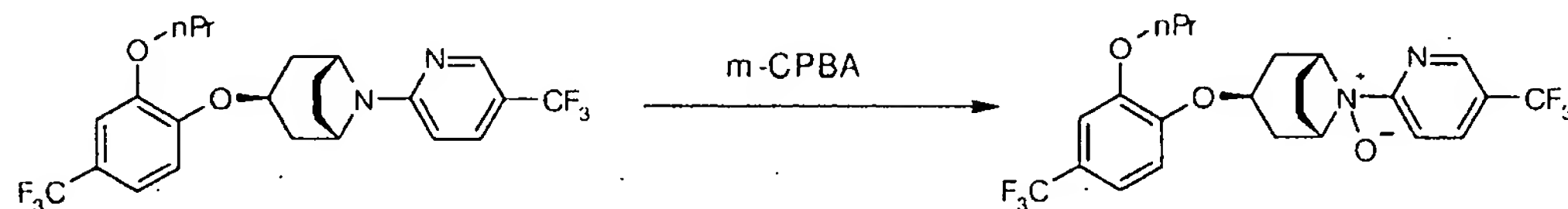
【0170】

実施例20

3α-[2-Propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-oxo-8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-8-azabicyclo[3.2.1]octaneの製造(化合物番号2-84)

【0171】

【化35】



【0172】

実施例12で得られた(化合物番号2-82)(0.48g)の塩化メチレン(5ml)溶液に、メタクロロ過安息香酸混合物(純度65%、0.28g)を室温で加えた。2時間加熱還流した後、混合物を塩化メチレンで希釈し、飽和亜硫酸ナトリウム水溶液、炭酸カリウム水溶液および飽和食塩水で1回ずつ洗浄した。無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(

0.28 g)を得た。

mp. 129–130°C

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.09 (t, 3H), 1.82–1.94 (m, 2H), 2.20–2.41 (m, 8H), 3.77 (br s, 2H), 3.97 (t, 2H), 4.54 (t, 1H), 6.81 (d, 1H), 7.08 (s, 1H), 7.15 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.86 (dd, 1H), 8.48 (s, 1H)

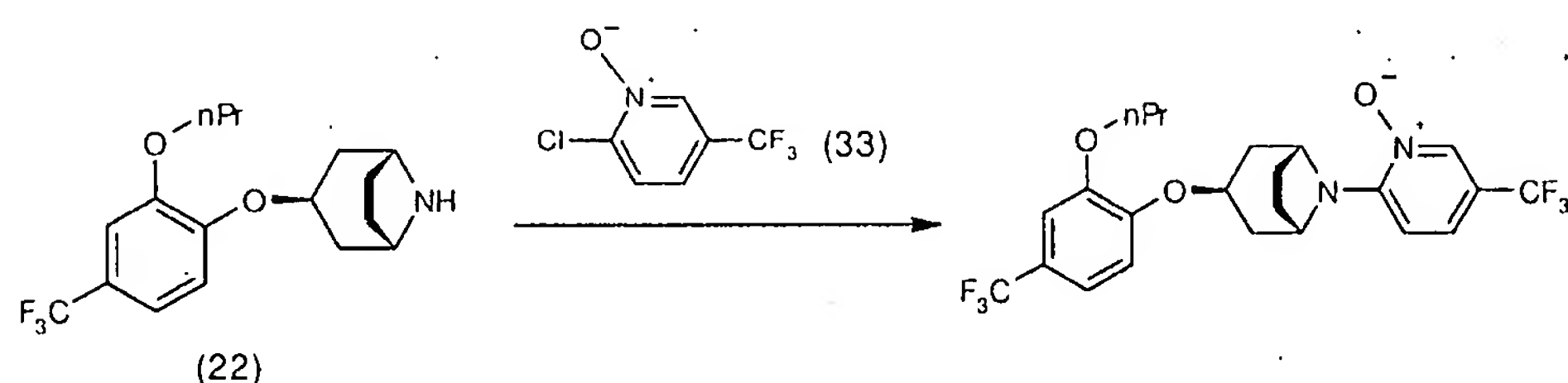
【0173】

実施例 21

3α-[2-Propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl-1-oxy]-8-azabicyclo[3.2.1]octaneの製造(化合物番号2-83)

【0174】

【化36】



【0175】

ピリジンN-オキシド(33)は、J. Heterocycl. Chem. 1976, 13, 41–42に記載された方法で合成した。実施例13で得られた(22)(0.65 g)のアセトニトリル(6 ml)懸濁液に、ピリジンN-オキシド(33)(0.395 g)と炭酸カリウム(0.82 g)を加え、混合物を8時間加熱還流した。混合物を冷却後、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮し、標記化合物(0.88 g)を得た。

mp. 143–145°C

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.08 (t, 3H), 1.83–1.90 (m, 2H), 2.04–2.15 (m, 4H), 2.25–2.31 (m, 2H), 2.44–2.48 (m, 2H), 3.97 (t, 2H), 4.68 (br s, 1H), 5.02 (br s, 2H), 6.79–6.84 (m, 2H), 7.08 (s, 1H), 7.15 (d, 1H), 7.23–7.33 (m, 1H), 8.39 (s, 1H)

【0176】

実施例 22

cis-3-Methyl-4-[2-propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]piperidineの製造(化合物番号1-97)

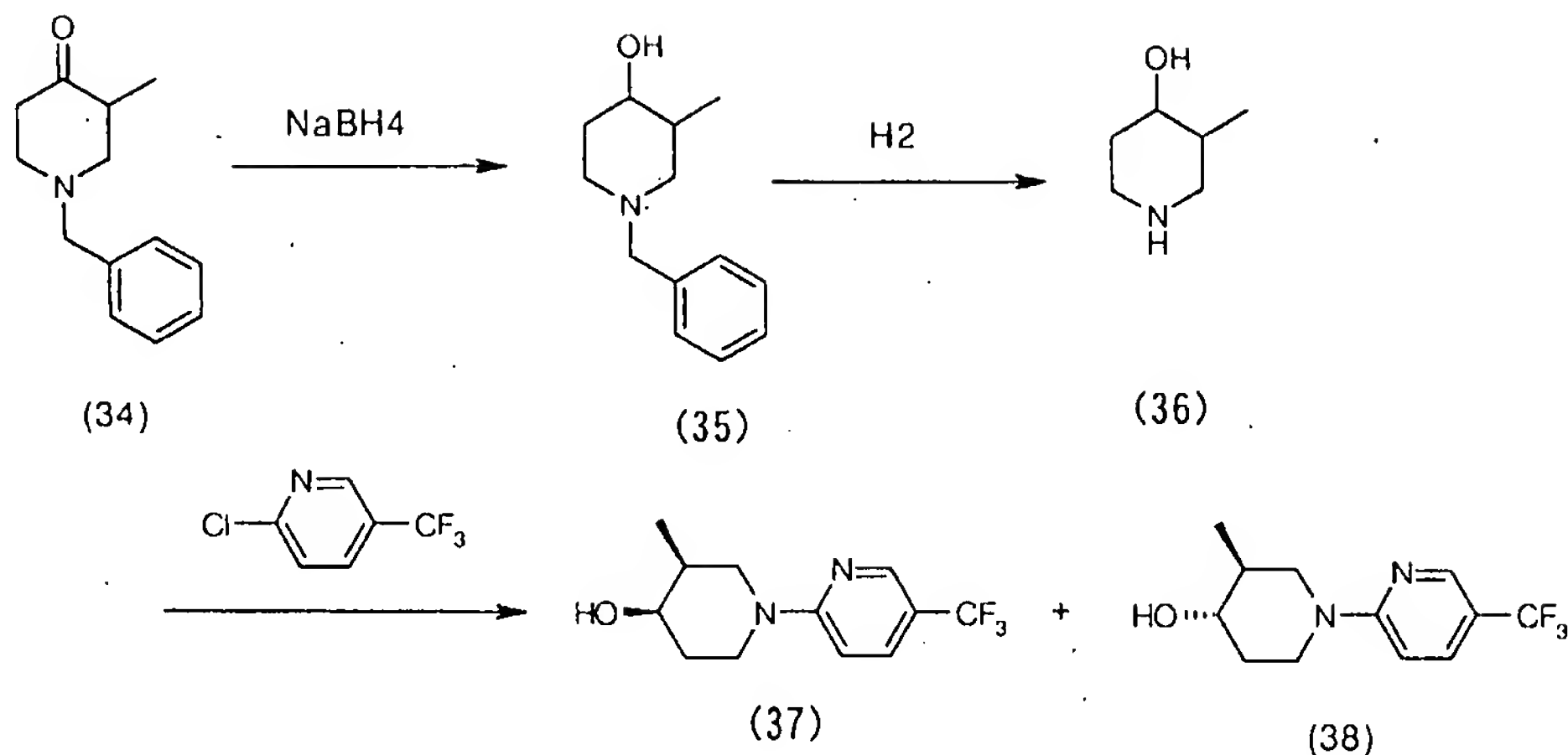
【0177】

工程1

cis-3-methyl-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-4-piperidinol(35)およびtrans-3-methyl-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-4-piperidinol(36)の製造

【0178】

【化 3 7】



【0 1 7 9】

N-Benzyl-3-methyl-4-piperidone (34) は、文献既知化合物 (CAS. no. [34737-89-8]) で、市販品もある。化合物 (34) (2.53 g) の EtOH (40 ml) 溶液に、氷冷下、水素化ホウ素ナトリウム (0.47 g) を加えた。混合物を室温下 2 時間攪拌した後、氷冷下、10% 塩酸で中和した。混合物を塩化メチレンで抽出し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、粗製の (35) (2.27 g) を得て、そのまま次の反応に用いた。

【0 1 8 0】

粗製の (35) (1.82 g) のメタノール (30 ml) 溶液に、20% 水酸化パラジウム-炭素 (0.2 g) を加えた。この懸濁液を水素雰囲気下、70℃ に昇温して 1 昼夜攪拌した。混合物を室温まで冷やした後、セライトを通してろ過した。ろ液に 20% 水酸化パラジウム-炭素 (0.9 g) を加え、70℃ に昇温して 1 晩攪拌した。混合物を室温まで冷やした後、セライトを通してろ過した。ろ液を減圧留去して、粗製の (36) (1.22 g) を得て、そのまま次の反応に用いた。

【0 1 8 1】

粗製の化合物 (36) (1.22 g) のアセトニトリル (50 ml) 溶液に、2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン (2.3 g) と炭酸カリウム (4.4 g) を加え、混合物を一晩加熱還流した。混合物を冷却後、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残査をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (37) (0.15 g) および (38) (0.55 g) を得た。

(37) : 黄色油状、 $^1\text{H}$ -NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.01 (d, 3H), 1.59 (br s, 1H), 1.77-1.94 (m, 3H), 3.21 (t, 1H), 3.44-3.53 (m, 1H), 3.85-3.98 (m, 3H), 6.65 (d, 1H), 7.58 (dd, 1H), 8.37 (s, 1H)

(38) : 黄色油状、 $^1\text{H}$ -NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.07 (d, 3H), 1.46-1.63 (m, 3H), 2.00-2.07 (m, 1H), 2.65 (t, 1H), 3.02 (t, 1H), 3.40-3.47 (m, 1H), 4.26-4.40 (m, 2H), 6.66 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 8.37 (s, 1H)

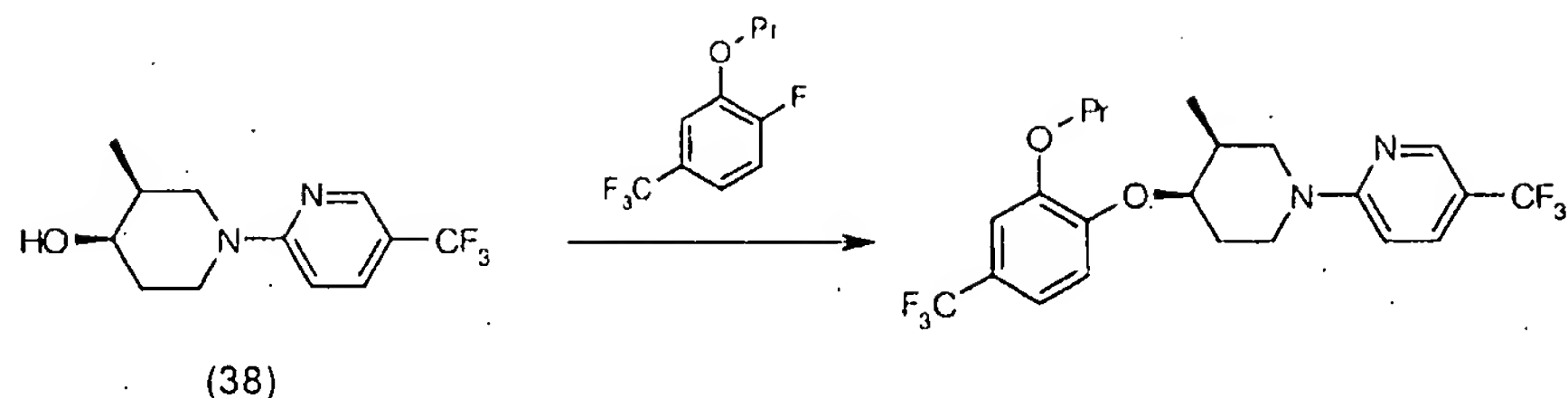
【0 1 8 2】

工程 2

cis-3-Methyl-4-[2-propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]piperidine の製造

【0 1 8 3】

【化 38】



【0184】

化合物(38)(0.15g)のDMF(4ml)溶液に、60%水素化ナトリウム(0.023g)を室温で加えた。混合物を70℃に昇温して4-フルオロ-3-プロポキシベンゾトリフルオライド(0.14g)を加え、100℃で一晩加熱した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(0.18g)を得た。

$n_D^{22.8} 1.5000$   $^1H$  NMR(CDC13)  $\delta$  1.05(t, 3H), 1.12(d, 3H), 1.71-1.92(m, 4H), 2.02-2.08(m, 2H), 3.40(t-like, 1H), 3.51(t-like, 1H), 3.95-4.05(m, 3H), 4.55(brs-like, 1H), 6.67(d, 1H), 7.00(d, 1H), 7.08(d, 1H), 7.16(d, 1H), 7.61(dd, 1H), 8.39(s, 1H)

【0185】

上記実施例を含め本発明化合物の具体例を第1表～第8表に記載する。本発明の権利範囲はこれら実施例および具体例に限定されるものではない。

表中の略記号は以下の意味を示す。

vis; 粘稠物

amor; アモルファス

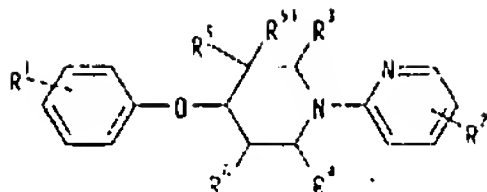
Me; メチル、Et; エチル、Pr; プロピル、Bu; ブチル、Hex; ヘキシル、Pen; ペンチル、i; イソ、n; ノルマル、t; ターシャリー、c; シクロ

Ac; アセチル

【0186】

【表 1】

表1



化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>51</sup>	R <sup>6</sup>	物理定数 [ ] : 融点 °C	備考
1-1	4-OH	5-CF3	H	H	H	H	H	nD22.2-1.5499	
1-2	3-OH	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-3	2-OH	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-4	2-OH-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	vis	
1-5	4-F	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-6	3-F	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-7	2-F	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-8	2-F-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	[72-74]	
1-9	3-CF3-4-F	5-CF3	H	H	H	H	H	nD23.1-1.5071	
1-10	4-Cl	5-CF3	H	H	H	H	H	[90-92]	
1-11	3-Cl	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-12	2-Cl	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-13	2-Cl-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	nD21.8-1.5210	
1-14	3-Cl-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-15	3-CF3-4-Cl	5-CF3	H	H	H	H	H	nD21.9-1.5275	
1-16	2,6-Cl2-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	[65-66]	
1-17	2-Br-4-CF3-6-Cl	5-CF3	H	H	H	H	H	[71-73]	
1-18	2-Cl-6-OPr-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	[70-72]	
1-19	4-Br	5-CF3	H	H	H	H	H	[87-90]	
1-20	3-Br	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-21	2-Br	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-22	2-Br-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	nD21.8-1.5320	
1-23	3-CF3-4-Br	5-CF3	H	H	H	H	H	nD21.9-1.5365	
1-24	4-I	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-25	3-I	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-26	2-I	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-27	2-I-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	vis	
1-28	2-CF3-4-I	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-29	4-CN	5-CF3	H	H	H	H	H	[157-161]	
1-30	3-CN	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-31	2-CN	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-32	2-CN-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	[101-102]	
1-33	2-CF3-4-CN	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-34	4-NO2	5-CF3	H	H	H	H	H	[140-144]	
1-35	3-NO2	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-36	2-NO2	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-37	2-Cl-4-CF3-6-NO2	5-CF3	H	H	H	H	H	[69-70]	
1-38	2-NO2-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	[96-97]	
1-39	3-CF3-4-NO2	5-CF3	H	H	H	H	H	vis	
1-40	2-CHO-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	[85-96]	

【表 2】

表1(続き)

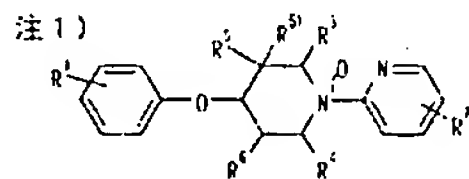
化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	物理定数 [ ] : 融点 °C	備考
1-41	4-Me	5-CF3	H	H	H	H	H	H		
1-42	3-Me	5-CF3	H	H	H	H	H	H		
1-43	2-Me	5-CF3	H	H	H	H	H	H		
1-44	2, 4-Me2	5-CF3	H	H	H	H	H	H	nD22.3-1.5410	
1-45	2-Me-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	H		
1-46	2-Me-4-OCF3	5-CF3	H	H	H	H	H	H	nD24.4-1.5089	
1-47	2, 4, 6-Me3	5-CF3	H	H	H	H	H	H	nD22.2-1.5339	
1-48	2-Me-4-F	5-CF3	H	H	H	H	H	H	nD24.3-1.5373	
1-49	2-Me-4-Cl	5-CF3	H	H	H	H	H	H	nD22.9-1.5535	
1-50	2-Me-4-Br	5-CF3	H	H	H	H	H	H		
1-51	2-Et-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	H		
1-52	2-Me-4-Cl	5-CF3	H	H	H	H	H	H		
1-53	2-Me-4-Br	5-CF3	H	H	H	H	H	H		
1-54	2-Et-4-Cl	5-CF3	H	H	H	H	H	H	nD24.6-1.5445	
1-55	2-Et-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	H		
1-56	2-Et-4-OCF3	5-CF3	H	H	H	H	H	H		
1-57	2- <sup>n</sup> Pr-4-Cl	5-CF3	H	H	H	H	H	H	nD24.9-1.5394	
1-58	2- <sup>n</sup> Pr-4-Br	5-CF3	H	H	H	H	H	H		
1-59	2- <sup>n</sup> Pr-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	H	nD22.5-1.5141	
1-60	2- <sup>i</sup> Pr-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	H		
1-61	2- <sup>i</sup> Pr-4-Cl	5-CF3	H	H	H	H	H	H		
1-62	2- <sup>i</sup> Pr-4-Br	5-CF3	H	H	H	H	H	H		
1-63	2-CH2OMe-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	H	nD26.2-1.5110	
1-64	2-CH2OMe-4-Cl	5-CF3	H	H	H	H	H	H		
1-65	2-CH2OMe-4-Br	5-CF3	H	H	H	H	H	H		
1-66	2-CH2OEt-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	H	nD23.3-1.5090	
1-67	2-CH(OH)Et-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	H	vis	
1-68	2-CH2OH-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	H	vis	
1-69	2-CH2OCH2OMe-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	H	vis	
1-70	3-CH2OCH2OMe-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	H		
1-71	2-CH2OCH2OEt-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	H	nD22.5-1.5069	
1-72	2-CH2OCH(Me)OMe-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	H	nD22.6-1.5018	
1-73	2-CH=CHMe-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	H	[68-71]	
1-74	2-allyl-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	H	vis	
1-75	4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	H	[48-50]	
1-76	3-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	H	nD23.1-1.5151	
1-77	2-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	H		
1-78	3, 4-(CF3)2	5-CF3	H	H	H	H	H	H		
1-79	3, 5-(CF3)2	5-CF3	H	H	H	H	H	H	nD21.6-1.4889	
1-80	2, 4-(CF3)2	5-CF3	H	H	H	H	H	H	vis	
1-81	2-CH2Cl-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	H	vis	
1-82	2-CH(Cl)Et-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	H	vis	
1-83	4-CF3	3-Cl-5-CF3	H	H	H	H	H	H	nD23.0-1.5150	
1-84	4-CF3	4-Me-6-CF3	H	H	H	H	H	H	nD23.2-1.5089	



【表 3】

表1(続き)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>51</sup>	R <sup>6</sup>	物理定数 [ ] : 融点 °C	備考
1-85	4-OMe	5-CF3	H	H	H	H	H	[66-88]	
1-86	3-OMe	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-87	2-OMe	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-88	2-OMe-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	nD22.8-1.5150	
1-89	2-OEt-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	[50-53]	
1-90	2-OEt-4-CF3	5-Cl	H	H	H	H	H	vis	
1-91	2-OEt-4-CF3	5-Br	H	H	H	H	H	[39-41]	
1-92	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	[55-65]	
1-93	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3	5-CF3	Me	H	H	H	H	vis	
1-94	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3	5-Me	H	H	H	H	H	nD21.4-1.5295	
1-95	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3	5-CF3	H	H	H	Me	CO2Et	vis	
1-96	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	nD22.2-1.4834	N-oxide(注1)
1-97	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3	5-CF3	H	H	Me	H	H	nD22.8-1.5000	cis
1-98	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3	5-CF3	H	H	Me	H	H	vis	trans
1-99	2-O <sup>n</sup> Pr-5-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	nD22.4-1.5088	
1-100	2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	nD25.3-1.5060	
1-101	2-O <sup>n</sup> Bu-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	[70-74]	
1-102	2-O <sup>i</sup> Bu-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	[103-104]	
1-103	2-O <sup>n</sup> Hex-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	[68-73]	
1-104	2-O <sup>n</sup> Pen-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-105	2-OC <sub>12</sub> H <sub>25</sub> -4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	nD23.9-1.4969	
1-106	2-OC <sub>12</sub> H <sub>25</sub> -4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-107	2-OC <sub>12</sub> H <sub>25</sub> -4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-108	2-OC <sub>12</sub> H <sub>25</sub> -4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	[49-51]	
1-109	2-OC <sub>12</sub> H <sub>25</sub> -4-CF3	5-CO2Me	H	H	H	H	H		
1-110	2-OC <sub>12</sub> H <sub>25</sub> -4-CHF2	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-111	2-OC <sub>12</sub> H <sub>25</sub> -4-CHO	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-112	2-OC <sub>12</sub> H <sub>25</sub> -4-CF3	5-CN	H	H	H	H	H		
1-113	2-OC <sub>12</sub> H <sub>25</sub> -4-CN	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-114	2-OC <sub>12</sub> H <sub>25</sub> -4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	vis	
1-115	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>20</sub> Me-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	[51-54]	
1-116	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>20</sub> Me-4-CF3	5-CN	H	H	H	H	H		
1-117	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>20</sub> CH <sub>2</sub> OMe-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	vis	
1-118	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>20</sub> H-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	nD22.2-1.5121	
1-119	2-OC <sub>12</sub> H <sub>25</sub> -4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-120	2-OC <sub>12</sub> H <sub>25</sub> (OH)Me-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-121	2-OC <sub>12</sub> H <sub>25</sub> (OMe)Me-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-122	2-OC <sub>12</sub> H <sub>25</sub> (OH)Me2-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-123	2-OC <sub>12</sub> H <sub>25</sub> (OMe)Me2-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-124	2-OC <sub>12</sub> H <sub>25</sub> (Me2)CO2Me-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-125	2-OC <sub>12</sub> H <sub>25</sub> (O)OMe-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-126	2-OC <sub>12</sub> H <sub>25</sub> (O)OEt-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-127	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>20</sub> Ac-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-128	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>20</sub> NH2-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-129	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>20</sub> NHAc-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-130	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>20</sub> NMe2-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-131	2-OC <sub>12</sub> H <sub>25</sub> (Cl)Me-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-132	2-OC <sub>12</sub> H <sub>25</sub> -CMe2-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H		



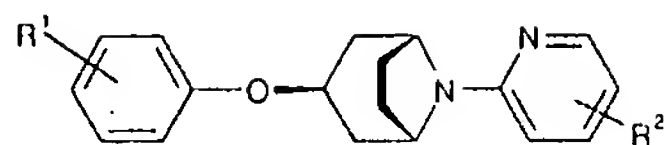
【表 4】

表1(続き)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>51</sup>	R <sup>6</sup>	物理定数 [ ] : 融点 ℃	備考
1-133	4-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	[30-32]	
1-134	3-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H		
1-135	2-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H		
1-136	4-OCF <sub>2</sub> Br	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	vis	
1-137	3-OCF <sub>2</sub> Br	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H		
1-138	2-OCF <sub>2</sub> Br	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H		
1-139	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Br-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	[82-84]	
1-140	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	vis	
1-141	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> F-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H		
1-142	2-allyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	[75-77]	
1-143	2-allyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	vis	
1-144	4-CO <sub>2</sub> Me	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	[124-126]	
1-145	3-CO <sub>2</sub> Me	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H		
1-146	2-CO <sub>2</sub> Me	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H		
1-147	4-SCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	[81-82]	
1-148	3-SCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H		
1-149	2-SCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H		
1-150	4-S(O)CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	[83-85]	
1-151	3-S(O)CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H		
1-152	2-S(O)CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H		
1-153	4-OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	[52-54]	
1-154	3-OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H		
1-155	2-OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H		
1-156	4-OC(O)Ph	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	[154-156]	
1-157	3-OC(O)Ph	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H		
1-158	2-OC(O)Ph	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H		
1-159	4-OCH <sub>2</sub> Ph	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	[109-110]	
1-160	3-OCH <sub>2</sub> Ph	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H		
1-161	2-OCH <sub>2</sub> Ph	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H		
1-162	4-OCH <sub>2</sub> (Naph-1-yl)	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	[123-124]	
1-163	2-Propargyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	vis	
1-164	2-(OCH <sub>2</sub> CH=CCl <sub>2</sub> )-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	[93-95]	
1-165	2,3,6-Cl <sub>3</sub> -4-OCH <sub>2</sub> CH=CCl <sub>2</sub>	3-Cl-5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	[58-60]	
1-166	2,3,6-Cl <sub>3</sub> -4-OCH <sub>2</sub> CH=CCl <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	vis	
1-167	2-OAc-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	[85-95]	
1-168	3-CF <sub>3</sub> -4-NH <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	nD <sub>21.6</sub> -1.5259	
1-169	2-NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	vis	
1-170	2-NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub> -6-Cl	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	vis	
1-171	2-NHMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H		
1-172	2-NHEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	vis	
1-173	2-NH <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	vis	
1-174	2-N( <sup>i</sup> Pr) <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	nD <sub>22.0</sub> -1.5121	
1-175	2-N(Ac) <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	[110-114]	
1-176	2-OC(O)OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	nD <sub>23.9</sub> -1.5000	
1-177	2-OC(O)SMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	[77-79]	
1-178	3-CF <sub>3</sub> -4-N(SO <sub>2</sub> Me) <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	amor	
1-179	2-C(O)Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	vis	

【表 5】

表2



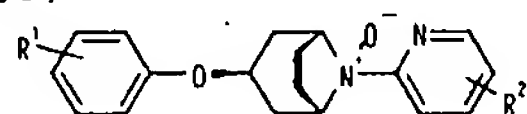
化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理定数 [ ] : 融点 °C	備考
2-1	4-OH	5-CF <sub>3</sub>		
2-2	3-OH	5-CF <sub>3</sub>		
2-3	2-OH	5-CF <sub>3</sub>		
2-4	2-OH-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[90-94]	
2-5	4-F	5-CF <sub>3</sub>		
2-6	3-F	5-CF <sub>3</sub>		
2-7	2-F	5-CF <sub>3</sub>		
2-8	2-F-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-9	3-CF <sub>3</sub> -4-F	5-CF <sub>3</sub>		
2-10	4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
2-11	3-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
2-12	2-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
2-13	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
2-14	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
2-15	2,6-Cl <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-16	2-Br-4-CF <sub>3</sub> -6-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
2-17	2-Cl-6- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-18	4-Br	5-CF <sub>3</sub>		
2-19	3-Br	5-CF <sub>3</sub>		
2-20	2-Br	5-CF <sub>3</sub>		
2-21	2-Br-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[112-115]	
2-22	3-CF <sub>3</sub> -4-Br	5-CF <sub>3</sub>		
2-23	4-I	5-CF <sub>3</sub>		
2-24	3-I	5-CF <sub>3</sub>		
2-25	2-I	5-CF <sub>3</sub>		
2-26	2-I-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-27	4-CN	5-CF <sub>3</sub>		
2-28	3-CN	5-CF <sub>3</sub>		
2-29	2-CN	5-CF <sub>3</sub>		
2-30	2-CN-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[110-113]	
2-31	4-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-32	3-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-33	2-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-34	2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -6-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-35	2-NO <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
2-36	3-CF <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-37	2-CHO-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		

【表 6】

(表2続き)

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理定数 [ ] : 融点 °C	備考
2-38	4-Me	5-CF <sub>3</sub>		
2-39	3-Me	5-CF <sub>3</sub>		
2-40	2-Me	5-CF <sub>3</sub>		
2-41	2, 4-Me <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-42	2-Me-3-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[121-123]	
2-43	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-44	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[88-91]	
2-45	2-Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-46	2, 4, 6-Me <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-47	2-Me-4-F	5-CF <sub>3</sub>	[98-100]	
2-48	2-Me-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
2-49	2-Et-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
2-50	2- <sup>n</sup> Pr-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
2-51	2- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
2-52	2- <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-53	2-CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-54	2-CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[91-93]	
2-55	2-CH(OH)Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-56	2-CH <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-57	2-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
2-58	2-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
2-59	2-CH <sub>2</sub> OCH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[89-91]	
2-60	2-CH <sub>2</sub> OCH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[95-98]	N-oxide(注2)
2-61	2-CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-62	2-allyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
2-63	4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-64	3-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-65	2-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-66	3, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-67	3, 5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
2-68	2, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-69	2-CH <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-70	2-CH(Cl)Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-71	4-CF <sub>3</sub>	3-Cl-5-CF <sub>3</sub>		
2-72	4-CF <sub>3</sub>	4-Me-6-CF <sub>3</sub>		
2-73	4-OMe	5-CF <sub>3</sub>		
2-74	3-OMe	5-CF <sub>3</sub>		
2-75	2-OMe	5-CF <sub>3</sub>		

注2)

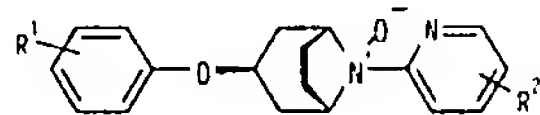


【表 7】

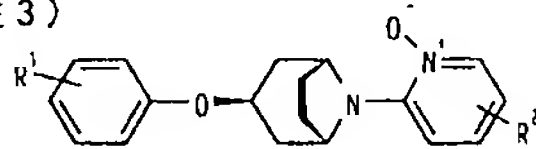
(表2続き)

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理定数 [ ] : 融点 °C	備考
2-76	2-OMe-4-CN	5-CF <sub>3</sub>	[85-90]	
2-77	2-OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
2-78	2-OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
2-79	2-OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-Cl		
2-80	2-OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-Br		
2-81	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CN	5-CF <sub>3</sub>	vis	
2-82	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[90-92]	
2-83	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[143-145]	N-oxide(注3)
2-84	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[129-130]	N-oxide(注2)
2-85	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-Cl	[92-97]	
2-86	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-Br	[50-52]	
2-87	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-NO <sub>2</sub>	[159-160]	
2-88	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-NH <sub>2</sub>	amor	
2-89	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-Me	[97-98]	
2-90	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-NHSO <sub>2</sub> Me	amor	
2-91	2-O <sup>n</sup> Pr-5-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-92	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	6-CF <sub>3</sub>	nD <sub>22.5</sub> -1.5090	
2-93	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CN	[124-125]	
2-94	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub> -6-CN	[132-134]	
2-95	2-Cl-6-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
2-96	2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[113-115]	
2-97	2-O <sup>n</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
2-98	2-O <sup>i</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[126-129]	
2-99	2-O <sup>n</sup> Hex-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-100	2-O <sup>n</sup> Pen-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
2-101	2-OCH <sub>2</sub> CN-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
2-102	2-OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[69-73]	
2-103	2-OCH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-104	2-OCH <sub>2</sub> O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-105	2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[114-116]	
2-106	2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CO <sub>2</sub> Me		
2-107	2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CHF <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-108	2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CHO	5-CF <sub>3</sub>		
2-109	2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CN		
2-110	2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CN	5-CF <sub>3</sub>		
2-111	2-OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[148-150]	
2-112	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
2-113	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CN		
2-114	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-115	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
2-116	2-OCH <sub>2</sub> Ac-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-117	2-OCH <sub>2</sub> CH(OH)Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-118	2-OCH <sub>2</sub> CH(OMe)Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		

注2)



注3)



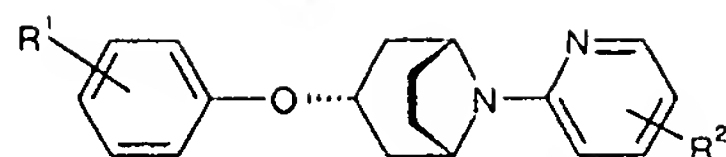
【表 8】

(表2続き)

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理定数 [ ] : 融点 °C	備考
2-119	2-OCH <sub>2</sub> C(OH)Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-120	2-OCH <sub>2</sub> C(OMe)Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-121	2-OCH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )CO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-122	2-OCH <sub>2</sub> C(O)OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-123	2-OCH <sub>2</sub> C(O)OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-124	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OAc-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-125	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-126	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NHAc-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-127	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-128	2-OCH <sub>2</sub> CH(Cl)Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-129	2-OCH <sub>2</sub> CH=CMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-130	2-OCH <sub>2</sub> CH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
2-131	4-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-132	3-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-133	2-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-134	4-OCF <sub>2</sub> Br	5-CF <sub>3</sub>		
2-135	3-OCF <sub>2</sub> Br	5-CF <sub>3</sub>		
2-136	2-OCF <sub>2</sub> Br	5-CF <sub>3</sub>		
2-137	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Br-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-138	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
2-139	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> F-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-140	2-OCH <sub>2</sub> (Ph-4-Cl)-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[115-118]	
2-141	2-Oallyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
2-142	2-Oallenyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
2-143	2-Opropargyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
2-144	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
2-145	2-OCH <sub>2</sub> CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[65-67]	cisとtransの混合物
2-146	2-OCH <sub>2</sub> CH=CMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[54-57]	
2-147	2-OCH <sub>2</sub> C(Me)=CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[96-98]	
2-148	2-OCH <sub>2</sub> CH=CHCl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	cisとtransの混合物
2-149	2-OAc-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[93-97]	
2-150	2-OC(O) <sup>t</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[112-115]	
2-151	2-OSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[107-110]	
2-152	2-OSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[121-124]	
2-153	2-SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	amor	
2-154	2-OSO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[133-136]	
2-155	2-OSO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[140-143]	
2-156	2-OC(S)NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[150-153]	
2-157	2-SC(O)NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[165-168]	
2-158	2-NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[87-91]	
2-159	2-N( <sup>n</sup> Pr) <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	amor	
2-160	2-NH <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[94-96]	
2-161	2-N(Me) <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
2-162	2-NHSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[165-168]	
2-163	2-NHSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[171-174]	
2-164	2-N(SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu) <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[181-183]	
2-165	2-S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[87-90]	
2-166	2-SCH <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[110-112]	
2-167	2-OP(O)(OEt)S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	



表3



化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理定数 [ ] : 融点 °C	備考
3-1	4-OH	5-CF <sub>3</sub>		
3-2	3-OH	5-CF <sub>3</sub>		
3-3	2-OH	5-CF <sub>3</sub>		
3-4	2-OH-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-5	4-F	5-CF <sub>3</sub>		
3-6	3-F	5-CF <sub>3</sub>		
3-7	2-F	5-CF <sub>3</sub>		
3-8	2-F-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-9	3-CF <sub>3</sub> -4-F	5-CF <sub>3</sub>		
3-10	4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
3-11	3-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
3-12	2-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
3-13	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-14	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
3-15	2,6-Cl <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-16	2-Br-4-CF <sub>3</sub> -6-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
3-17	2-Cl-6-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-18	4-Br	5-CF <sub>3</sub>		
3-19	3-Br	5-CF <sub>3</sub>		
3-20	2-Br	5-CF <sub>3</sub>		
3-21	2-Br-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-22	3-CF <sub>3</sub> -4-Br	5-CF <sub>3</sub>		
3-23	4-I	5-CF <sub>3</sub>		
3-24	3-I	5-CF <sub>3</sub>		
3-25	2-I	5-CF <sub>3</sub>		
3-26	2-I-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-27	4-CN	5-CF <sub>3</sub>		
3-28	3-CN	5-CF <sub>3</sub>		
3-29	2-CN	5-CF <sub>3</sub>		
3-30	2-CN-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-31	4-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-32	3-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-33	2-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-34	2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -6-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-35	2-NO <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-36	3-CF <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-37	2-CHO-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		

表3(続き)

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理定数 [ ] : 融点 °C	備考
3-38	4-Me	5-CF <sub>3</sub>		
3-39	3-Me	5-CF <sub>3</sub>		
3-40	2-Me	5-CF <sub>3</sub>		
3-41	2, 4-Me <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-42	2-Me-3-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-43	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-44	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-45	2-Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-46	2, 4, 6-Me <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-47	2-Me-4-F	5-CF <sub>3</sub>		
3-48	2-Me-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
3-49	2-Et-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
3-50	2- <sup>n</sup> Pr-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
3-51	2- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-52	2- <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-53	2-CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-54	2-CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-55	2-CH(OH)Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-56	2-CH <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-57	2-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-58	2-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-59	2-CH <sub>2</sub> OCH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-60	2-CH <sub>2</sub> OCH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-61	2-CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-62	2-allyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
3-63	4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[56-58]	
3-64	3-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-65	2-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-66	3, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-67	3, 5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-68	2, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-69	2-CH <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-70	2-CH(Cl)Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-71	4-CF <sub>3</sub>	3-Cl-5-CF <sub>3</sub>		
3-72	4-CF <sub>3</sub>	4-Me-6-CF <sub>3</sub>		
3-73	4-OMe	5-CF <sub>3</sub>		
3-74	3-OMe	5-CF <sub>3</sub>		
3-75	2-OMe	5-CF <sub>3</sub>		

【表 1 1】

表3(続き)

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理定数 [ ] : 融点 °C	備考
3-76	2-OMe-4-CN	5-CF <sub>3</sub>		
3-77	2-OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-78	2-OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-79	2-OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-Cl		
3-80	2-OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-Br		
3-81	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CN	5-CF <sub>3</sub>		
3-82	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[56-58]	
3-83	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-84	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-85	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-Cl		
3-86	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-Br		
3-87	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-NO <sub>2</sub>		
3-88	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-NH <sub>2</sub>		
3-89	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-Me		
3-90	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-NHSO <sub>2</sub> Me		
3-91	2-O <sup>n</sup> Pr-5-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-92	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	6-CF <sub>3</sub>		
3-93	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CN		
3-94	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub> -6-CN		
3-95	2-Cl-6-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-96	2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-97	2-O <sup>n</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-98	2-O <sup>i</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-99	2-O <sup>n</sup> Hex-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-100	2-O <sup>n</sup> Pen-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-101	2-OCH <sub>2</sub> CN-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-102	2-OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-103	2-OCH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-104	2-OCH <sub>2</sub> O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-105	2-OCH <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-106	2-OCH <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CO <sub>2</sub> Me		
3-107	2-OCH <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pr-4-CHF <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-108	2-OCH <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pr-4-CHO	5-CF <sub>3</sub>		
3-109	2-OCH <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CN		
3-110	2-OCH <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pr-4-CN	5-CF <sub>3</sub>		
3-111	2-OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-112	2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-113	2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CN		
3-114	2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-115	2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-116	2-OCH <sub>2</sub> Ac-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-117	2-OCH <sub>2</sub> CH (OH) Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-118	2-OCH <sub>2</sub> CH (OMe) Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-119	2-OCH <sub>2</sub> C (OH) Me <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-120	2-OCH <sub>2</sub> C (OMe) Me <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-121	2-OCH <sub>2</sub> C (Me <sub>2</sub> ) CO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-122	2-OCH <sub>2</sub> C (O) OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-123	2-OCH <sub>2</sub> C (O) OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-124	2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OAc-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-125	2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-126	2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NHAc-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-127	2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		

【 0 1 9 7 】

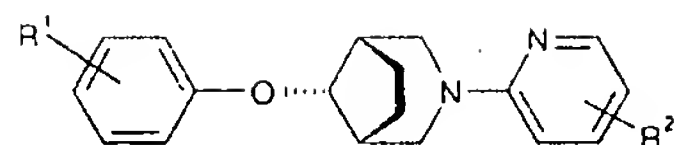
【表 1 2】

表3(続き)

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理定数 [ ] : 融点 °C	備考
3-128	2-OCH <sub>2</sub> CH (Cl) Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-129	2-OCH <sub>2</sub> CH=CMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-130	2-OCH <sub>2</sub> CH (Me) OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-131	3-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-132	2-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-133	4-OCF <sub>2</sub> Br	5-CF <sub>3</sub>		
3-134	3-OCF <sub>2</sub> Br	5-CF <sub>3</sub>		
3-135	2-OCF <sub>2</sub> Br	5-CF <sub>3</sub>		
3-136	2-O (CH <sub>2</sub> ) 2Br-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-137	2-O (CH <sub>2</sub> ) 2Cl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-138	2-O (CH <sub>2</sub> ) 2F-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-139	2-OCH <sub>2</sub> (Ph-4-Cl) -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-140	2-Oallyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-141	2-Oallenyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-142	2-Opropargyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-143	2-O (CH <sub>2</sub> ) 2CH=CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-144	2-OCH <sub>2</sub> CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-145	2-OCH <sub>2</sub> CH=CMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-146	2-OCH <sub>2</sub> C (Me) =CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-147	2-OCH <sub>2</sub> CH=CHCl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-148	2-OAc-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-149	2-OC (O) <sup>t</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-150	2-OSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-151	2-OSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-152	2-SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-153	2-OSO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-154	2-OSO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-155	2-OC (S) NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-156	2-SC (O) NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-157	2-NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-158	2-N ( <sup>n</sup> Pr) 2-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-159	2-NH <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-160	2-N (Me) <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-161	2-NHSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-162	2-NHSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-163	2-N (SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu) 2-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-164	2-S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-165	2-SCH <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
3-166	2-OP (O) (OEt) S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		

【 0 1 9 8 】

表4



化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理定数 [ ] : 融点 °C	備考
4-1	4-OH	5-CF <sub>3</sub>		
4-2	3-OH	5-CF <sub>3</sub>		
4-3	2-OH	5-CF <sub>3</sub>		
4-4	2-OH-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-5	4-F	5-CF <sub>3</sub>		
4-6	3-F	5-CF <sub>3</sub>		
4-7	2-F	5-CF <sub>3</sub>		
4-8	2-F-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-9	3-CF <sub>3</sub> -4-F	5-CF <sub>3</sub>		
4-10	4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
4-11	3-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
4-12	2-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
4-13	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-14	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
4-15	2,6-Cl <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-16	2-Br-4-CF <sub>3</sub> -6-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
4-17	2-Cl-6- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-18	4-Br	5-CF <sub>3</sub>		
4-19	3-Br	5-CF <sub>3</sub>		
4-20	2-Br	5-CF <sub>3</sub>		
4-21	2-Br-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-22	3-CF <sub>3</sub> -4-Br	5-CF <sub>3</sub>		
4-23	4-I	5-CF <sub>3</sub>		
4-24	3-I	5-CF <sub>3</sub>		
4-25	2-I	5-CF <sub>3</sub>		
4-26	2-I-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-27	4-CN	5-CF <sub>3</sub>		
4-28	3-CN	5-CF <sub>3</sub>		
4-29	2-CN	5-CF <sub>3</sub>		
4-30	2-CN-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-31	4-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-32	3-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-33	2-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-34	2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -6-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-35	2-NO <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-36	3-CF <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-37	2-CHO-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		

表4(続き)

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理定数 [] : 融点 °C	備考
4-38	4-Me	5-CF <sub>3</sub>		
4-39	3-Me	5-CF <sub>3</sub>		
4-40	2-Me	5-CF <sub>3</sub>		
4-41	2, 4-Me <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-42	2-Me-3-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-43	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-44	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-45	2-Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-46	2, 4, 6-Me <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-47	2-Me-4-F	5-CF <sub>3</sub>		
4-48	2-Me-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
4-49	2-Et-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
4-50	2- <sup>n</sup> Pr-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
4-51	2- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-52	2- <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-53	2-CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-54	2-CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-55	2-CH(OH)Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-56	2-CH <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-57	2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-58	2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-59	2-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-60	2-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-61	2-CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-62	2-allyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-63	4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-64	3-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-65	2-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-66	3, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-67	3, 5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-68	2, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-69	2-CH <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-70	2-CH(Cl)Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-71	4-CF <sub>3</sub>	3-Cl-5-CF <sub>3</sub>		
4-72	4-CF <sub>3</sub>	4-Me-6-CF <sub>3</sub>		
4-73	4-OMe	5-CF <sub>3</sub>		
4-74	3-OMe	5-CF <sub>3</sub>		
4-75	2-OMe	5-CF <sub>3</sub>		



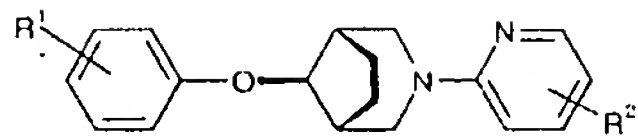
表4(続き)

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理定数 [ ] : 融点 °C	備考
4-76	2-OMe-4-CN	5-CF <sub>3</sub>		
4-77	2-OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-78	2-OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-79	2-OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-Cl		
4-80	2-OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-Br		
4-81	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CN	5-CF <sub>3</sub>		
4-82	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[55-57]	
4-83	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-84	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-85	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-Cl		
4-86	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-Br		
4-87	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-NO <sub>2</sub>		
4-88	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-NH <sub>2</sub>		
4-89	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-Me		
4-90	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-NHSO <sub>2</sub> Me		
4-91	2-O <sup>n</sup> Pr-5-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-92	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	6-CF <sub>3</sub>		
4-93	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CN		
4-94	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub> -6-CN		
4-95	2-Cl-6-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-96	2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-97	2-O <sup>n</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-98	2-O <sup>i</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-99	2-O <sup>n</sup> Hex-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-100	2-O <sup>n</sup> Pen-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-101	2-OCH <sub>2</sub> CN-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-102	2-OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-103	2-OCH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-104	2-OCH <sub>2</sub> O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-105	2-OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-106	2-OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CO <sub>2</sub> Me		
4-107	2-OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr-4-CHF <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-108	2-OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr-4-CHO	5-CF <sub>3</sub>		
4-109	2-OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CN		
4-110	2-OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr-4-CN	5-CF <sub>3</sub>		
4-111	2-OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-112	2-O (CH <sub>2</sub> ) 2OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-113	2-O (CH <sub>2</sub> ) 2OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CN		
4-114	2-O (CH <sub>2</sub> ) 2OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-115	2-O (CH <sub>2</sub> ) 2OH-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-116	2-OCH <sub>2</sub> Ac-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-117	2-OCH <sub>2</sub> CH (OH) Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-118	2-OCH <sub>2</sub> CH (OMe) Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-119	2-OCH <sub>2</sub> C (OH) Me <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-120	2-OCH <sub>2</sub> C (OMe) Me <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-121	2-OCH <sub>2</sub> C (Me <sub>2</sub> ) CO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-122	2-OCH <sub>2</sub> C (O) OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-123	2-OCH <sub>2</sub> C (O) OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-124	2-O (CH <sub>2</sub> ) 2OAc-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-125	2-O (CH <sub>2</sub> ) 2NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-126	2-O (CH <sub>2</sub> ) 2NHAc-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-127	2-O (CH <sub>2</sub> ) 2NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		

表4(続き)

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理定数 [ ] : 融点 °C	備考
4-128	2-OCH <sub>2</sub> CH (Cl) Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-129	2-OCH <sub>2</sub> CH=CM <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-130	2-OCH <sub>2</sub> CH (Me) OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-131	4-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-132	3-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-133	2-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-134	4-OCF <sub>2</sub> Br	5-CF <sub>3</sub>		
4-135	3-OCF <sub>2</sub> Br	5-CF <sub>3</sub>		
4-136	2-OCF <sub>2</sub> Br	5-CF <sub>3</sub>		
4-137	2-O (CH <sub>2</sub> ) 2Br-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-138	2-O (CH <sub>2</sub> ) 2Cl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-139	2-O (CH <sub>2</sub> ) 2F-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-140	2-OCH <sub>2</sub> (Ph-4-Cl) -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-141	2-Oallyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-142	2-Oallynyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-143	2-Opropargyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-144	2-O (CH <sub>2</sub> ) 2CH=CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-145	2-OCH <sub>2</sub> CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-146	2-OCH <sub>2</sub> CH=CM <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-147	2-OCH <sub>2</sub> C (Me) =CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-148	2-OCH <sub>2</sub> CH=CHCl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-149	2-OAc-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-150	2-OC (O) <sup>t</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-151	2-OSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-152	2-OSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-153	2-SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-154	2-OSO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-155	2-OSO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-156	2-OC (S) NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-157	2-SC (O) NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-158	2-NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-159	2-N ( <sup>n</sup> Pr) 2-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-160	2-NH <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-161	2-N (Me) <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-162	2-NHSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-163	2-NHSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-164	2-N (SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu) 2-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-165	2-S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-166	2-SCH <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
4-167	2-OP (O) (OEt) S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		

表5



化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理定数 [ ] : 融点 °C	備考
5-1	4-OH	5-CF <sub>3</sub>		
5-2	3-OH	5-CF <sub>3</sub>		
5-3	2-OH	5-CF <sub>3</sub>		
5-4	2-OH-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	amor	
5-5	4-F	5-CF <sub>3</sub>		
5-6	3-F	5-CF <sub>3</sub>		
5-7	2-F	5-CF <sub>3</sub>		
5-8	2-F-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-9	3-CF <sub>3</sub> -4-F	5-CF <sub>3</sub>		
5-10	4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
5-11	3-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
5-12	2-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
5-13	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-14	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-15	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
5-16	2,6-Cl <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-17	2-Br-4-CF <sub>3</sub> 6-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
5-18	2-Cl-6- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-19	4-Br	5-CF <sub>3</sub>		
5-20	3-Br	5-CF <sub>3</sub>		
5-21	2-Br	5-CF <sub>3</sub>		
5-22	2-Br-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[85-87]	
5-23	3-CF <sub>3</sub> -4-Br	5-CF <sub>3</sub>		
5-24	4-I	5-CF <sub>3</sub>		
5-25	3-I	5-CF <sub>3</sub>		
5-26	2-I	5-CF <sub>3</sub>		
5-27	2-I-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-28	2-CF <sub>3</sub> -4-I	5-CF <sub>3</sub>		
5-29	4-CN	5-CF <sub>3</sub>		
5-30	3-CN	5-CF <sub>3</sub>		
5-31	2-CN	5-CF <sub>3</sub>		
5-32	2-CN-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[125-126]	
5-33	2-CF <sub>3</sub> -4-CN	5-CF <sub>3</sub>		
5-34	4-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-35	3-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-36	2-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-37	2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -6-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-38	2-NO <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[107-109]	
5-39	3-CF <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-40	2-CHO-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		

表5(続き)

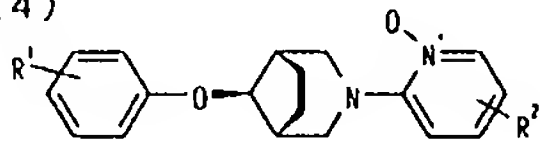
化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理定数 [] : 融点 °C	備考
5-41	4-Me	5-CF <sub>3</sub>		
5-42	3-Me	5-CF <sub>3</sub>		
5-43	2-Me	5-CF <sub>3</sub>		
5-44	2, 4-Me <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-45	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-46	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-47	2, 4, 6-Me <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-48	2-Me-4-F	5-CF <sub>3</sub>		
5-49	2-Me-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
5-50	2-Me-4-Br	5-CF <sub>3</sub>		
5-51	2-Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-52	2-Me-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
5-53	2-Me-4-Br	5-CF <sub>3</sub>		
5-54	2-Et-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
5-55	2-Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-56	2-Et-4-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-57	2- <sup>n</sup> Pr-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
5-58	2- <sup>n</sup> Pr-4-Br	5-CF <sub>3</sub>		
5-59	2- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-60	2- <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-61	2- <sup>i</sup> Pr-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
5-62	2- <sup>i</sup> Pr-4-Br	5-CF <sub>3</sub>		
5-63	2-CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-64	2-CH <sub>2</sub> OMe-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
5-65	2-CH <sub>2</sub> OMe-4-Br	5-CF <sub>3</sub>		
5-66	2-CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-67	2-CH(OH)Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-68	2-CH <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-69	2-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-70	3-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	nd22.5-1.5110	
5-71	2-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-72	2-CH <sub>2</sub> OCH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[56-57]	
5-73	2-CH(Me)OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-74	2-CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-75	2-allyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	amor	
5-76	4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-77	3-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-78	2-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-79	3, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-80	3, 5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-81	2, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-82	2-CH <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-83	2-CH(Cl)Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-84	4-CF <sub>3</sub>	3-Cl-5-CF <sub>3</sub>		
5-85	4-CF <sub>3</sub>	4-Me-6-CF <sub>3</sub>		
5-86	4-OMe	5-CF <sub>3</sub>		
5-87	3-OMe	5-CF <sub>3</sub>		
5-88	2-OMe	5-CF <sub>3</sub>		
5-89	2-OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-90	2-OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-91	2-OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-Cl		

【表 1 9】

表5(続き)

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理定数 [ ] : 融点 °C	備考
5-92	2-OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-Br		
5-93	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CH <sub>2</sub> F	vis	
5-94	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-Me		
5-95	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-96	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CN	[95-97]	
5-97	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[48-50]	
5-98	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	N-oxide(注4)
5-99	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CHF <sub>2</sub>	vis	
5-100	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CHO	[98-100]	
5-101	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CH <sub>2</sub> OH	vis	
5-102	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CN	5-CF <sub>3</sub>	[97-101]	
5-103	3-O <sup>n</sup> Pr-5-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-104	2-(O <sup>s</sup> Pr-2, 2-CI <sub>2</sub> )-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-105	2-O <sup>i</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[74-77]	
5-106	2-OBn-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	ND22.3-1.5441	
5-107	2-O <sup>i</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-108	2-O <sup>n</sup> Hex-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-109	2-O <sup>n</sup> Pen-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-110	2-OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[86-88]	
5-111	2-OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CN	[117-119]	
5-112	2-OCH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-113	2-OCH <sub>2</sub> O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-114	2-OCH <sub>2</sub> CH(Me)OAc-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-115	2-OCH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )OAc-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-116	2-OCH <sub>2</sub> <sup>s</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[51-53]	
5-117	2-OCH <sub>2</sub> <sup>s</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CO <sub>2</sub> Me	[136-138]	
5-118	2-OCH <sub>2</sub> <sup>s</sup> Pr-4-CHF <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-119	2-OCH <sub>2</sub> <sup>s</sup> Pr-4-CHO	5-CF <sub>3</sub>	[106-109]	
5-120	2-OCH <sub>2</sub> <sup>s</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CN	[87-89]	
5-121	2-OCH <sub>2</sub> <sup>s</sup> Pr-4-CN	5-CF <sub>3</sub>	[109-112]	
5-122	2-OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-123	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-124	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-125	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CN	[90-92]	
5-126	2-OCH <sub>2</sub> Ac-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-127	2-OCH <sub>2</sub> CH(OH)Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-128	2-OCH <sub>2</sub> CH(OMe)Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-129	2-OCH <sub>2</sub> C(OH)Me <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-130	2-OCH <sub>2</sub> C(OMe)Me <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-131	2-OCH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )CO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-132	2-OCH <sub>2</sub> C(O)OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-133	2-OCH <sub>2</sub> C(O)OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-134	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OAc-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-135	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[61-62]	
5-136	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NHAc-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-137	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-138	2-OCH <sub>2</sub> CH(CI)Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-139	2-OCH <sub>2</sub> CH=CMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	

注4)

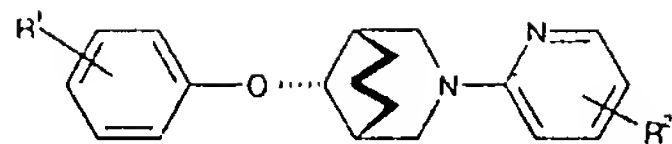


【表 2 0】

表5(続き)				
化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理定数 [ ] : 融点 ℃	備考
5-140	4-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-141	3-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-142	2-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-143	4-OCF <sub>2</sub> Bz	5-CF <sub>3</sub>		
5-144	3-OCF <sub>2</sub> Bz	5-CF <sub>3</sub>		
5-145	2-OCF <sub>2</sub> Bz	5-CF <sub>3</sub>		
5-146	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Bz-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-147	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C1-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-148	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> F-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-149	2-allyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[47-51]	
5-150	2-allyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-151	4-CO <sub>2</sub> Me	5-CF <sub>3</sub>		
5-152	3-CO <sub>2</sub> Me	5-CF <sub>3</sub>		
5-153	2-CO <sub>2</sub> Me	5-CF <sub>3</sub>		
5-154	4-SCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-155	3-SCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-156	2-SCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-157	4-S(O)CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-158	3-S(O)CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-159	2-S(O)CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-160	4-OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-161	2-CO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[159-161]	
5-162	2-OSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[123-126]	
5-163	2-OSO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-164	2-OSO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[109-112]	
5-165	3-OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-166	2-OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-167	4-OC(O)Ph	5-CF <sub>3</sub>		
5-168	3-OC(O)Ph	5-CF <sub>3</sub>		
5-169	2-OC(O)Ph	5-CF <sub>3</sub>		
5-170	4-OCH <sub>2</sub> Ph	5-CF <sub>3</sub>		
5-171	3-OCH <sub>2</sub> Ph	5-CF <sub>3</sub>		
5-172	2-OCH <sub>2</sub> Ph	5-CF <sub>3</sub>		
5-173	4-OCH <sub>2</sub> (Naph-1-yl)	5-CF <sub>3</sub>		
5-174	2-OCH <sub>2</sub> C(Me)=CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[70-74]	
5-175	2-OCH <sub>2</sub> CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	cisとtransの混合物
5-176	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-177	2-Propargyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	
5-178	2-(OCH <sub>2</sub> CH=CCl <sub>2</sub> )-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-179	2,3,6-Cl <sub>3</sub> -4-OCH <sub>2</sub> CH=CCl <sub>2</sub>	3-Cl-5-CF <sub>3</sub>		
5-180	2,3,6-Cl <sub>3</sub> -4-OCH <sub>2</sub> CH=CCl <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-181	2-OAc-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[157-159]	
5-182	2-OCH <sub>2</sub> C(=NOMe)Me-4-CHO(anti)	5-CF <sub>3</sub>	[120-123]	
5-183	2-OCH <sub>2</sub> C(=NOMe)Me-4-CHO(syn)	5-CF <sub>3</sub>	[55-59]	
5-184	2-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> C(=NOMe)Me-4-CHO(anti)	5-CF <sub>3</sub>	nd23.6-1.5100	
5-185	3-CF <sub>3</sub> -4-NH <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-186	2-NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[110-113]	
5-187	2-NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub> -6-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
5-188	2-NHMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-189	2-NHEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-190	2-NH <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[65-67]	
5-191	2-N(Me) <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[64-67]	
5-192	2-N( <sup>i</sup> Pr) <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-193	2-NHAc-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[130-132]	
5-194	2-N(Ac) <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-195	2-OC(O)OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-196	2-OC(O)OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-197	3-CF <sub>3</sub> -4-N(SO <sub>2</sub> Me) <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
5-198	2-OC(O)F1-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[101-105]	
5-199	2-OC(O) <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[104-106]	
5-200	2-OC(O) <sup>i</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[127-130]	
5-201	2-NHSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[179-182]	
5-202	2-( <sup>i</sup> Pr-2,2-Cl <sub>2</sub> )-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis	



表6



化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理定数 [ ] : 融点 °C
6-1	4-OH	5-CF <sub>3</sub>	
6-2	3-OH	5-CF <sub>3</sub>	
6-3	2-OH	5-CF <sub>3</sub>	
6-4	2-OH-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	amor
6-5	4-F	5-CF <sub>3</sub>	
6-6	3-F	5-CF <sub>3</sub>	
6-7	2-F	5-CF <sub>3</sub>	
6-8	2-F-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-9	3-CF <sub>3</sub> -4-F	5-CF <sub>3</sub>	
6-10	4-Cl	5-CF <sub>3</sub>	
6-11	3-Cl	5-CF <sub>3</sub>	
6-12	2-Cl	5-CF <sub>3</sub>	
6-13	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-14	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl	5-CF <sub>3</sub>	
6-15	2,6-Cl <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-16	2-Br-4-CF <sub>3</sub> -6-Cl	5-CF <sub>3</sub>	
6-17	2-Cl-6- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-18	4-Br	5-CF <sub>3</sub>	
6-19	3-Br	5-CF <sub>3</sub>	
6-20	2-Br	5-CF <sub>3</sub>	
6-21	2-Br-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-22	3-CF <sub>3</sub> -4-Br	5-CF <sub>3</sub>	
6-23	4-I	5-CF <sub>3</sub>	
6-24	3-I	5-CF <sub>3</sub>	
6-25	2-I	5-CF <sub>3</sub>	
6-26	2-I-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-27	4-CN	5-CF <sub>3</sub>	
6-28	3-CN	5-CF <sub>3</sub>	
6-29	2-CN	5-CF <sub>3</sub>	
6-30	2-CN-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-31	4-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-32	3-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-33	2-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-34	2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -6-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-35	2-NO <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-36	3-CF <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-37	2-CHO-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	

表6(続き)

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理定数 [ ] : 融点 °C
6-38	4-Me	5-CF <sub>3</sub>	
6-39	3-Me	5-CF <sub>3</sub>	
6-40	2-Me	5-CF <sub>3</sub>	
6-41	2, 4-Me <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-42	2-Me-3-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-43	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-44	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-45	2-Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-46	2, 4, 6-Me <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-47	2-Me-4-F	5-CF <sub>3</sub>	
6-48	2-Me-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>	
6-49	2-Et-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>	
6-50	2- <sup>n</sup> Pr-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>	
6-51	2- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-52	2- <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-53	2-CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-54	2-CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-55	2-CH(OH)Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-56	2-CH <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-57	2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-58	2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-59	2-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-60	2-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-61	2-CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-62	2-allyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-63	4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-64	3-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-65	2-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-66	3, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-67	3, 5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-68	2, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-69	2-CH <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-70	2-CH(Cl)Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-71	4-CF <sub>3</sub>	3-Cl-5-CF <sub>3</sub>	
6-72	4-CF <sub>3</sub>	4-Me-6-CF <sub>3</sub>	
6-73	4-OMe	5-CF <sub>3</sub>	
6-74	3-OMe	5-CF <sub>3</sub>	
6-75	2-OMe	5-CF <sub>3</sub>	

表6(続き)

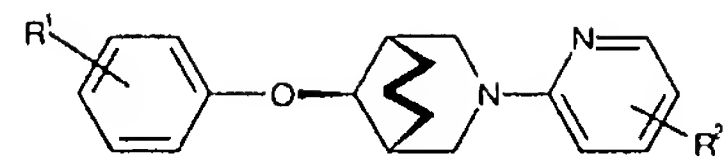
化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理定数 [ ] : 融点 °C
6-76	2-OMe-4-CN	5-CF <sub>3</sub>	
6-77	2-OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-78	2-OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-79	2-OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-Cl	
6-80	2-OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-Br	
6-81	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CN	5-CF <sub>3</sub>	
6-82	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	vis
6-83	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-84	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-85	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-Cl	
6-86	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-Br	
6-87	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-NO <sub>2</sub>	
6-88	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-NH <sub>2</sub>	
6-89	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-Me	
6-90	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-NHSO <sub>2</sub> Me	
6-91	2-O <sup>n</sup> Pr-5-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-92	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	6-CF <sub>3</sub>	
6-93	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CN	
6-94	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub> -6-CN	
6-95	2-Cl-6-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-96	2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-97	2-O <sup>n</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-98	2-O <sup>i</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-99	2-O <sup>n</sup> Hex-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-100	2-O <sup>n</sup> Pen-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-101	2-OCH <sub>2</sub> CN-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-102	2-OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	{70-74}
6-103	2-OCH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-104	2-OCH <sub>2</sub> O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-105	2-OCH <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-106	2-OCH <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CO <sub>2</sub> Me	
6-107	2-OCH <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pr-4-CHF <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-108	2-OCH <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pr-4-CHO	5-CF <sub>3</sub>	
6-109	2-OCH <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CN	
6-110	2-OCH <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pr-4-CN	5-CF <sub>3</sub>	
6-111	2-OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-112	2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-113	2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CN	
6-114	2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-115	2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-116	2-OCH <sub>2</sub> Ac-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-117	2-OCH <sub>2</sub> CH (OH) Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-118	2-OCH <sub>2</sub> CH (OMe) Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-119	2-OCH <sub>2</sub> C (OH) Me <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-120	2-OCH <sub>2</sub> C (OMe) Me <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-121	2-OCH <sub>2</sub> C (Me <sub>2</sub> ) CO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-122	2-OCH <sub>2</sub> C (O) OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-123	2-OCH <sub>2</sub> C (O) OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-124	2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OAc-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-125	2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-126	2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NHAc-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-127	2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	

表6(続き)

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理定数 [ ] : 融点 °C
6-128	2-OCH <sub>2</sub> CH(Cl)Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-129	2-OCH <sub>2</sub> CH=CMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-130	2-OCH <sub>2</sub> CH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-131	4-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-132	3-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-133	2-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-134	4-OCF <sub>2</sub> Br	5-CF <sub>3</sub>	
6-135	3-OCF <sub>2</sub> Br	5-CF <sub>3</sub>	
6-136	2-OCF <sub>2</sub> Br	5-CF <sub>3</sub>	
6-137	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Br-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-138	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-139	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> F-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-140	2-OCH <sub>2</sub> (Ph-4-Cl)-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-141	2-allyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-142	2-allylenyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-143	2-propargyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-144	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-145	2-OCH <sub>2</sub> CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-146	2-OCH <sub>2</sub> CH=CMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-147	2-OCH <sub>2</sub> C(Me)=CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-148	2-OCH <sub>2</sub> CH=CHCl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-149	2-OAc-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-150	2-OC(O) <sup>t</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-151	2-OSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-152	2-OSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-153	2-SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-154	2-OSO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-155	2-OSO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-156	2-OC(S)NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-157	2-SC(O)NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-158	2-NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-159	2-N( <sup>n</sup> Pr) <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-160	2-NH <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-161	2-N(Me) <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-162	2-NHSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-163	2-NHSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-164	2-N(SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu) <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-165	2-S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-166	2-SCH <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
6-167	2-OP(O)(OEt)S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	

【表 2 5】

表7



化合物番号	R 1	R 2	物理定数 [ ] : 融点 °C
7-1	4-OH	5-CF3	
7-2	3-OH	5-CF3	
7-3	2-OH	5-CF3	
7-4	2-OH-4-CF3	5-CF3	[108-110]
7-5	4-F	5-CF3	
7-6	3-F	5-CF3	
7-7	2-F	5-CF3	
7-8	2-F-4-CF3	5-CF3	
7-9	3-CF3-4-F	5-CF3	
7-10	4-Cl	5-CF3	
7-11	3-Cl	5-CF3	
7-12	2-Cl	5-CF3	
7-13	2-Cl-4-CF3	5-CF3	
7-14	3-CF3-4-Cl	5-CF3	
7-15	2,6-Cl2-4-CF3	5-CF3	
7-16	2-Br-4-CF3-6-Cl	5-CF3	
7-17	2-Cl-6-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3	5-CF3	
7-18	4-Br	5-CF3	
7-19	3-Br	5-CF3	
7-20	2-Br	5-CF3	
7-21	2-Br-4-CF3	5-CF3	
7-22	3-CF3-4-Br	5-CF3	
7-23	4-I	5-CF3	
7-24	3-I	5-CF3	
7-25	2-I	5-CF3	
7-26	2-I-4-CF3	5-CF3	
7-27	4-CN	5-CF3	
7-28	3-CN	5-CF3	
7-29	2-CN	5-CF3	
7-30	2-CN-4-CF3	5-CF3	
7-31	4-NO2	5-CF3	
7-32	3-NO2	5-CF3	
7-33	2-NO2	5-CF3	
7-34	2-Cl-4-CF3-6-NO2	5-CF3	
7-35	2-NO2-4-CF3	5-CF3	
7-36	3-CF3-4-NO2	5-CF3	
7-37	2-CHO-4-CF3	5-CF3	

【表 2 6】

表7(続き)

化合物番号	R 1	R 2	物理定数 [] : 融点 °C
7-39	3-Me	5-CF <sub>3</sub>	
7-40	2-Me	5-CF <sub>3</sub>	
7-41	2, 4-Me <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-42	2-Me-3-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-43	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-44	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-45	2-Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-46	2, 4, 6-Me <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-47	2-Me-4-F	5-CF <sub>3</sub>	
7-48	2-Me-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>	
7-49	2-Et-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>	
7-50	2- <sup>n</sup> Pr-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>	
7-51	2- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-52	2- <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-53	2-CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-54	2-CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-55	2-CH(OH) Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-56	2-CH <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-57	2-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-58	2-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-59	2-CH <sub>2</sub> OCH(Me) OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-60	2-CH <sub>2</sub> OCH(Me) OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-61	2-CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-62	2-allyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-63	4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-64	3-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-65	2-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-66	3, 4- (CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-67	3, 5- (CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-68	2, 4- (CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-69	2-CH <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-70	2-CH(Cl) Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-71	4-CF <sub>3</sub>	3-Cl-5-CF <sub>3</sub>	
7-72	4-CF <sub>3</sub>	4-Me-6-CF <sub>3</sub>	
7-73	4-OMe	5-CF <sub>3</sub>	
7-74	3-OMe	5-CF <sub>3</sub>	
7-75	2-OMe	5-CF <sub>3</sub>	



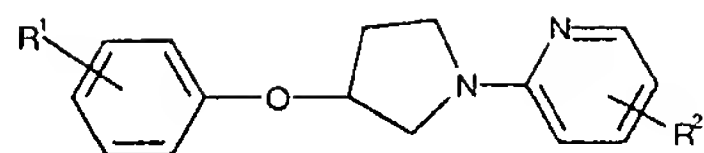
表7(続き)

化合物番号	R 1	R 2	物理定数 [ ] : 融点 °C
7-76	2-OMe-4-CN	5-CF3	
7-77	2-OMe-4-CF3	5-CF3	
7-78	2-OEt-4-CF3	5-CF3	
7-79	2-OEt-4-CF3	5-Cl	
7-80	2-OEt-4-CF3	5-Br	
7-81	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CN	5-CF3	
7-82	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3	5-CF3	vis
7-83	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3	5-Cl	
7-84	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3	5-Br	
7-85	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3	5-NO2	
7-86	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3	5-NH2	
7-87	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3	5-Me	
7-88	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3	5-NHSO2Me	
7-89	2-O <sup>n</sup> Pr-5-CF3	5-CF3	
7-90	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3	6-CF3	
7-91	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3	5-CN	
7-92	2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3	5-CF3-6-CN	
7-93	2-Cl-6-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3	5-CF3	
7-94	2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF3	5-CF3	
7-95	2-O <sup>n</sup> Bu-4-CF3	5-CF3	
7-96	2-O <sup>i</sup> Bu-4-CF3	5-CF3	
7-97	2-O <sup>n</sup> Hex-4-CF3	5-CF3	
7-98	2-O <sup>n</sup> Pen-4-CF3	5-CF3	
7-99	2-OCH2CN-4-CF3	5-CF3	
7-100	2-OCH2OMe-4-CF3	5-CF3	vis
7-101	2-OCH2OEt-4-CF3	5-CF3	
7-102	2-OCH2O <sup>n</sup> Pr-4-CF3	5-CF3	
7-103	2-OCH2 <sup>i</sup> Pr-4-CF3	5-CF3	vis
7-104	2-OCH2 <sup>i</sup> Pr-4-CF3	5-CO2Me	
7-105	2-OCH2 <sup>i</sup> Pr-4-CHF2	5-CF3	
7-106	2-OCH2 <sup>i</sup> Pr-4-CHO	5-CF3	
7-107	2-OCH2 <sup>i</sup> Pr-4-CF3	5-CN	
7-108	2-OCH2 <sup>i</sup> Pr-4-CN	5-CF3	
7-109	2-OCH2 <sup>i</sup> Bu-4-CF3	5-CF3	
7-110	2-O (CH2) 2OMe-4-CF3	5-CF3	
7-111	2-O (CH2) 2OMe-4-CF3	5-CN	
7-112	2-O (CH2) 2OCH2OMe-4-CF3	5-CF3	
7-113	2-O (CH2) 2OH-4-CF3	5-CF3	
7-114	2-OCH2Ac-4-CF3	5-CF3	
7-115	2-OCH2CH (OH) Me-4-CF3	5-CF3	
7-116	2-OCH2CH (OMe) Me-4-CF3	5-CF3	
7-117	2-OCH2C (OH) Me2-4-CF3	5-CF3	
7-118	2-OCH2C (OMe) Me2-4-CF3	5-CF3	
7-119	2-OCH2C (Me2) CO2Me-4-CF3	5-CF3	
7-120	2-OCH2C (O) OMe-4-CF3	5-CF3	
7-121	2-OCH2C (O) OEt-4-CF3	5-CF3	
7-122	2-O (CH2) 2OAc-4-CF3	5-CF3	
7-123	2-O (CH2) 2NH2-4-CF3	5-CF3	
7-124	2-O (CH2) 2NHAc-4-CF3	5-CF3	
7-125	2-O (CH2) 2NMe2-4-CF3	5-CF3	

表7(続き)

化合物番号	R 1	R 2	物理定数 [ ] : 融点 °C
7-126	2-OCH <sub>2</sub> CH (Cl) Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-127	2-OCH <sub>2</sub> CH=CMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-128	2-OCH <sub>2</sub> CH (Me) OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-129	4-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-130	3-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-131	2-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-132	4-OCF <sub>2</sub> Br	5-CF <sub>3</sub>	
7-133	3-OCF <sub>2</sub> Br	5-CF <sub>3</sub>	
7-134	2-OCF <sub>2</sub> Br	5-CF <sub>3</sub>	
7-135	2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Br-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-136	2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-137	2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> F-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-138	2-OCH <sub>2</sub> (Ph-4-Cl) -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-139	2-allyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-140	2-allyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-141	2-propargyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-142	2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-143	2-OCH <sub>2</sub> CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-144	2-OCH <sub>2</sub> CH=CMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-145	2-OCH <sub>2</sub> C (Me) =CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-146	2-OCH <sub>2</sub> CH=CHCl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-147	2-OAc-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-148	2-OC (O) <sup>t</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-149	2-OSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-150	2-OSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-151	2-SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-152	2-OSO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-153	2-OSO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-154	2-OC (S) NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-155	2-SC (O) NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-156	2-NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-157	2-N ( <sup>n</sup> Pr) <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-158	2-NH <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-159	2-N (Me) <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-160	2-NHSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-161	2-NHSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-162	2-N (SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu) <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-163	2-S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-164	2-SCH <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	
7-165	2-OP (O) (OEt) S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	

表8



化合物番号	$R^1$	$R^2$	物理定数 [ ] : 融点 °C	備考
8-1	4-OH	5-CF <sub>3</sub>		
8-2	3-OH	5-CF <sub>3</sub>		
8-3	2-OH	5-CF <sub>3</sub>		
8-4	2-OH-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-5	4-F	5-CF <sub>3</sub>		
8-6	3-F	5-CF <sub>3</sub>		
8-7	2-F	5-CF <sub>3</sub>		
8-8	2-F-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-9	3-CF <sub>3</sub> -4-F	5-CF <sub>3</sub>		
8-10	4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
8-11	3-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
8-12	2-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
8-13	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-14	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
8-15	2,6-Cl <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-16	2-Br-4-CF <sub>3</sub> -6-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
8-17	2-Cl-6- <i>n</i> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-18	4-Br	5-CF <sub>3</sub>		
8-19	3-Br	5-CF <sub>3</sub>		
8-20	2-Br	5-CF <sub>3</sub>		
8-21	2-Br-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-22	3-CF <sub>3</sub> -4-Br	5-CF <sub>3</sub>		
8-23	4-I	5-CF <sub>3</sub>		
8-24	3-I	5-CF <sub>3</sub>		
8-25	2-I	5-CF <sub>3</sub>		
8-26	2-I-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-27	4-CN	5-CF <sub>3</sub>		
8-28	3-CN	5-CF <sub>3</sub>		
8-29	2-CN	5-CF <sub>3</sub>		
8-30	2-CN-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-31	4-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-32	3-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-33	2-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-34	2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -6-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-35	2-NO <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-36	3-CF <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-37	2-CHO-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		

表8(続き)

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理定数 [ ] : 融点 °C	備考
8-38	4-Me	5-CF <sub>3</sub>		
8-39	3-Me	5-CF <sub>3</sub>		
8-40	2-Me	5-CF <sub>3</sub>		
8-41	2, 4-Me <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-42	2-Me-3-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-43	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-44	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-45	2-Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-46	2, 4, 6-Me <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-47	2-Me-4-F	5-CF <sub>3</sub>		
8-48	2-Me-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
8-49	2-Et-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
8-50	2- <sup>n</sup> Pr-4-Cl	5-CF <sub>3</sub>		
8-51	2- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-52	2- <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-53	2-CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-54	2-CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-55	2-CH(OH)Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-56	2-CH <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-57	2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-58	2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-59	2-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-60	2-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-61	2-CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-62	2-allyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-63	4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[109-112]	
8-64	3-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-65	2-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-66	3, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-67	3, 5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-68	2, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-69	2-CH <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-70	2-CH(Cl)Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-71	4-CF <sub>3</sub>	3-Cl-5-CF <sub>3</sub>		
8-72	4-CF <sub>3</sub>	4-Me-6-CF <sub>3</sub>		
8-73	4-OMe	5-CF <sub>3</sub>		
8-74	3-OMe	5-CF <sub>3</sub>		
8-75	2-OMe	5-CF <sub>3</sub>		

表8(続き)				
化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理定数 [ ] : 融点 °C	備考
8-76	2-OMe-4-CN	5-CF3		
8-77	2-OMe-4-CF3	5-CF3		
8-78	2-OEt-4-CF3	5-CF3		
8-79	2-OEt-4-CF3	5-Cl		
8-80	2-OEt-4-CF3	5-Br		
8-81	2-O <sup>i</sup> Pr-4-CN	5-CF3		
8-82	2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF3	5-CF3	[47-50]	
8-83	2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF3	5-Cl		
8-84	2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF3	5-Br		
8-85	2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF3	5-NO2		
8-86	2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF3	5-NH2		
8-87	2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF3	5-Me		
8-88	2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF3	5-NHSO2Me		
8-89	2-O <sup>i</sup> Pr-5-CF3	5-CF3		
8-90	2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF3	6-CF3		
8-91	2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF3	5-CN		
8-92	2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF3	5-CF3-6-CN		
8-93	2-Cl-6-O <sup>i</sup> Pr-4-CF3	5-CF3		
8-94	2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF3	5-CF3		
8-95	2-O <sup>i</sup> Bu-4-CF3	5-CF3		
8-96	2-O <sup>i</sup> Bu-4-CF3	5-CF3		
8-97	2-O <sup>i</sup> Hex-4-CF3	5-CF3		
8-98	2-O <sup>i</sup> Pen-4-CF3	5-CF3		
8-99	2-OCH2CN-4-CF3	5-CF3		
8-100	2-OCH2OMe-4-CF3	5-CF3		
8-101	2-OCH2OEt-4-CF3	5-CF3		
8-102	2-OCH2O <sup>i</sup> Pr-4-CF3	5-CF3		
8-103	2-OCH2 <sup>i</sup> Pr-4-CF3	5-CF3		
8-104	2-OCH2 <sup>i</sup> Pr-4-CF3	5-CO2Me		
8-105	2-OCH2 <sup>i</sup> Pr-4-CHF2	5-CF3		
8-106	2-OCH2 <sup>i</sup> Pr-4-CHO	5-CF3		
8-107	2-OCH2 <sup>i</sup> Pr-4-CF3	5-CN		
8-108	2-OCH2 <sup>i</sup> Pr-4-CN	5-CF3		
8-109	2-OCH2 <sup>i</sup> Bu-4-CF3	5-CF3		
8-110	2-O (CH2) 2OMe-4-CF3	5-CF3		
8-111	2-O (CH2) 2OMe-4-CF3	5-CN		
8-112	2-O (CH2) 2OCH2OMe-4-CF3	5-CF3		
8-113	2-O (CH2) 2OH-4-CF3	5-CF3		
8-114	2-OCH2Ac-4-CF3	5-CF3		
8-115	2-OCH2CH (OH) Me-4-CF3	5-CF3		
8-116	2-OCH2CH (OMe) Me-4-CF3	5-CF3		
8-117	2-OCH2C (OH) Me2-4-CF3	5-CF3		
8-118	2-OCH2C (OMe) Me2-4-CF3	5-CF3		
8-119	2-OCH2C (Me2) CO2Me-4-CF3	5-CF3		
8-120	2-OCH2C (O) OMe-4-CF3	5-CF3		
8-121	2-OCH2C (O) OEt-4-CF3	5-CF3		
8-122	2-O (CH2) 2OAc-4-CF3	5-CF3		
8-123	2-O (CH2) 2NH2-4-CF3	5-CF3		
8-124	2-O (CH2) 2NHAc-4-CF3	5-CF3		
8-125	2-O (CH2) 2NMe2-4-CF3	5-CF3		
8-126	2-OCH2CH (Cl) Me-4-CF3	5-CF3		
8-127	2-OCH2CH=OMe2-4-CF3	5-CF3		
8-128	2 OCH2CH (Me) OMe-4-CF3	5-CF3		

【表 3 2】

表8(続き)

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理定数 [ ] : 融点 °C	備考
8-129	4-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	[35-38]	
8-130	3-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-131	2-OCF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-132	4-OCF <sub>2</sub> Br	5-CF <sub>3</sub>		
8-133	3-OCF <sub>2</sub> Br	5-CF <sub>3</sub>		
8-134	2-OCF <sub>2</sub> Br	5-CF <sub>3</sub>		
8-135	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Br-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-136	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-137	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> F-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-138	2-OCH <sub>2</sub> (Ph-4-Cl)-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-139	2-allyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-140	2-allyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-141	2-propargyl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-142	2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-143	2-OCH <sub>2</sub> CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-144	2-OCH <sub>2</sub> CH=CMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-145	2-OCH <sub>2</sub> C(Me)=CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-146	2-OCH <sub>2</sub> CH=CHCl-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-147	2-OAc-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-148	2-OC(O) <sup>t</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-149	2-OSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-150	2-OSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-151	2-SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-152	2-OSO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-153	2-OSO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-154	2-OC(S)NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-155	2-SC(O)NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-156	2-NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-157	2-N( <sup>n</sup> Pr) <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-158	2-NH <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-159	2-N(Me) <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-160	2-NHSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-161	2-NHSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-162	2-N(SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu) <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-163	2-S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-164	2-SCH <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		
8-165	2-OP(O)(OEt)S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>		

【0218】

NMR データ

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>)

化合物番号 1-169

δ 1.85-1.95 (m, 2H), 2.05-2.24 (m, 2H), 3.57-3.65 (m, 2H), 3.93-4.01 (m, 4H), 4.62-4.69 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.86 (d, 1H), 6.96 (a set of s and d, 2H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 1-80

δ 1.98-2.05 (m, 4H), 3.69-3.78 (m, 2H), 3.86-3.

9.4 (m, 2H), 4.82-4.86 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 7.10 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.86 (s, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 1-143

$\delta$  1.89-2.06 (m, 4H), 3.61-3.70 (m, 2H), 3.91-4.00 (m, 2H), 4.63-4.67 (m, 1H), 5.42 (d, 2H), 6.68 (d, 1H), 6.85 (t, 1H), 7.03 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.36 (s, 1H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物番号 1-163

$\delta$  1.86-2.09 (m, 4H), 2.53 (t, 1H), 3.57-3.66 (m, 2H), 3.94-4.03 (m, 2H), 4.60-4.67 (m, 1H), 4.77 (d, 1H), 6.68 (d, 1H), 7.02 (d, 1H), 7.24-7.29 (m, 2H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物番号 1-172

$\delta$  1.29 (t, 3H), 1.83-1.94 (m, 2H), 2.04-2.14 (m, 2H), 3.15-3.24 (m, 2H), 3.53-3.62 (m, 2H), 3.95-4.01 (m, 2H), 4.23 (br s, 1H), 4.61-4.67 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.77-6.89 (m, 3H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

【0219】

化合物番号 1-69

$\delta$  1.88-2.09 (m, 4H), 3.41 (s, 3H), 3.66-3.74 (m, 2H), 3.84-3.93 (m, 2H), 4.66 (s, 2H), 4.68-4.75 (m, 3H), 6.68 (d, 1H), 6.95 (d, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.71 (s, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 1-173

$\delta$  1.00 (t, 3H), 1.67 (q, 2H), 1.86-1.93 (m, 2H), 2.06-2.12 (m, 2H), 3.07-3.15 (m, 2H), 3.55-3.63 (m, 2H), 3.93-4.01 (m, 2H), 4.32 (br s, 1H), 4.64-4.66 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.77-6.90 (m, 3H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 1-140

$\delta$  1.87-2.06 (m, 4H), 3.60-3.68 (m, 2H), 3.84 (t, 2H), 3.86-3.99 (m, 2H), 4.30 (t, 2H), 4.63-4.68 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 7.03 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.22 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 1-74

$\delta$  1.91-2.08 (m, 4H), 3.42 (d, 2H), 3.74-3.86 (m, 4H), 4.69-4.71 (m, 1H), 5.04-5.10 (m, 2H), 5.91-6.00 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.92 (d, 1H), 7.42-7.47 (m, 2H), 7.64 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

化合物番号 1-67

$\delta$  0.97 (t, 3H), 1.74-1.95 (m, 4H), 2.04-2.14 (m, 3H), 3.66-3.73 (m, 2H), 3.85-3.94 (m, 2H), 4.71-4.74 (m, 1H), 4.93-4.96 (m, 1H), 6.69 (d, 1H), 6.94 (d, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.69 (s, 1H), 8.40 (s, 1H)

【0220】

化合物番号 2-57

$\delta$  2.00-2.31 (m, 8H), 3.44 (s, 3H), 4.58-4.64 (m,



3 H), 4.70 (s, 2H), 4.79 (s, 2H), 6.57 (d, 1H), 6.72 (d, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.72 (s, 1H), 8.41 (s, 1H)

化合物番号 2-58

$\delta$  1.25 (t, 3H), 2.00-2.29 (m, 8H), 3.68 (q, 2H), 4.58-4.64 (m, 3H), 4.71 (s, 2H), 4.84 (s, 2H), 6.57 (d, 1H), 6.72 (d, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.72 (s, 1H), 8.41 (s, 1H)

化合物番号 2-78

$\delta$  1.46 (t, 3H), 2.00-2.21 (m, 6H), 2.44-2.46 (m, 2H), 4.10 (q, 2H), 4.55 (brs, 2H), 4.61 (brs, 1H), 6.56 (d, 1H), 6.78 (d, 1H), 7.08 (d, 1H), 7.15 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 2-141

$\delta$  2.01-2.31 (m, 6H), 2.40-2.47 (m, 2H), 4.56-4.63 (m, 5H), 5.32 (d, 1H), 5.46 (d, 1H), 6.01-6.14 (m, 1H), 6.55 (d, 1H), 6.78 (d, 1H), 7.11 (s, 1H), 7.17 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 3-62

$\delta$  1.78-1.93 (m, 4H), 2.14-2.19 (m, 4H), 3.28 (d, 2H), 4.69 (brs, 2H), 4.83-4.90 (m, 1H), 4.95-5.02 (m, 2H), 5.77-5.91 (m, 1H), 6.59 (d, 1H), 6.92 (d, 1H), 7.35 (s, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.65 (d, 1H), 8.43 (s, 1H)

【0221】

化合物番号 2-148

$\delta$  2.00-2.23 (m, 6H), 2.35-2.44 (m, 2H), 4.56-4.61 (m, 4H), 4.82 (q, 1H), 6.06-6.64 (m, 2H), 6.56 (d, 1H), 6.78 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 2-144

$\delta$  1.99-2.20 (m, 6H), 2.40-2.47 (m, 2H), 2.57-2.64 (m, 2H), 4.07 (t, 2H), 4.55-4.60 (m, 3H), 5.14 (dd, 2H), 5.86-5.99 (m, 1H), 6.56 (d, 1H), 6.77 (d, 1H), 7.08 (s, 1H), 7.12 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 2-115

$\delta$  2.00-2.30 (m, 7H), 2.35-2.44 (m, 2H), 3.97-4.03 (m, 2H), 4.16 (t, 2H), 4.52-4.65 (brs, plus t, 3H), 6.56 (d, 1H), 6.78 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.19 (d, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 2-153

$\delta$  1.05 (t, 3H), 1.76-1.84 (m, 2H), 2.03 (d, 2H), 2.17-2.20 (m, 2H), 2.36-2.40 (m, 4H), 3.36 (t, 2H), 4.61 (brs, 2H), 4.72 (t, 1H), 6.58 (d, 1H), 6.92 (d, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 8.28 (s, 1H), 8.42 (s, 1H)

化合物番号 2-112

$\delta$  2.00-2.21 (m, 6H), 2.39-2.47 (m, 2H), 3.44 (s, 3H), 3.79 (t, 2H), 4.16 (t, 2H), 4.56 (brs, 2H), 4

. 6 2 (b r s, 1H), 6. 5 5 (d, 1H), 6. 7 8 (d, 1H), 7. 1 2 (s, 1H), 7. 1 8 (d, 1H), 7. 6 1 (d, 1H), 8. 4 0 (s, 1H)

【0 2 2 2】

化合物番号 2-1 6 1

δ 0. 8 9 (t, 3H), 1. 4 7-1. 6 3 (m, 2H), 2. 0 7-2. 1 1 (m, 4H), 2. 1 9-2. 2 7 (m, 2H), 2. 3 8-2. 4 5 (m, 2H), 2. 8 0 (s, 3H), 3. 0 8 (t, 2H), 4. 5 6 (b r s, 2H), 4. 6 0 (t, 1H), 6. 5 6 (d, 1H), 6. 7 2 (d, 1H), 7. 1 5 (s, 1H), 7. 1 7 (d, 1H), 7. 6 0 (d d, 1H), 8. 4 0 (s, 1H)

化合物番号 2-1 4 3

δ 2. 0 0-2. 2 4 (m, 6H), 2. 3 8-2. 4 5 (m, 2H), 2. 5 4-2. 5 6 (m, 1H), 4. 5 6-4. 6 3 (b r s plus t, 3H), 4. 7 7 (d, 2H), 6. 5 6 (d, 1H), 6. 7 9 (d, 1H), 7. 2 2 (s, 1H), 7. 2 5 (d, 1H), 7. 6 1 (d d, 1H), 8. 4 0 (s, 1H)

化合物番号 2-1 3 8

δ 2. 0 5-2. 2 6 (m, 6H), 2. 4 1-2. 4 8 (m, 2H), 3. 8 7 (t, 2H), 4. 3 1 (t, 2H), 4. 6 1-4. 6 4 (b r s plus t, 3H), 6. 5 6 (d, 1H), 6. 8 0 (d, 1H), 7. 0 9 (s, 1H), 7. 2 0 (d, 1H), 7. 6 0 (d d, 1H), 8. 4 0 (s, 1H)

化合物番号 2-1 0 1

δ 2. 1 1-2. 4 0 (m, 8H), 4. 5 8 (b r s, 2H), 4. 6 5 (t, 1H), 4. 8 6 (s, 2H), 6. 5 7 (d, 1H), 6. 7 3 (d, 1H), 7. 2 7 (s, 1H), 7. 3 7 (d, 1H), 7. 6 2 (d d, 1H), 8. 4 1 (s, 1H)

化合物番号 5-1 7 5

δ 1. 5 7-1. 6 4 (m, 2H), 1. 7 5 (d, 3H), 2. 0 3-2. 0 6 (m, 2H), 2. 5 8 (b r s, 2H), 3. 0 8 (d, 2H), 4. 1 8 (d d, 2H), 4. 5 1 (d, 2H), 4. 6 2-4. 6 7 (m, 1H), 5. 6 6-5. 9 0 (m, 2H), 6. 6 1 (d, 1H), 7. 0 1 (d, 1H), 7. 1 3 (s, 1H), 7. 2 0 (d, 1H), 7. 6 2 (d d, 1H), 8. 3 9 (s, 1H)

【0 2 2 3】

化合物番号 5-8 9

δ 1. 5 7-1. 6 9 (m, 2H), 2. 0 3-2. 0 7 (m, 2H), 2. 5 9 (b r s, 2H), 3. 1 0 (d, 2H), 3. 8 9 (s, 3H), 4. 1 8 (d, 2H), 4. 6 2 (s, 1H), 6. 6 1 (d, 1H), 7. 0 1 (d, 1H), 7. 1 1 (s, 1H), 7. 1 8 (d, 1H), 7. 6 2 (d d, 1H), 8. 3 9 (s, 1H)

化合物番号 5-9 0

δ 1. 4 5 (t, 3H), 1. 5 7-1. 6 8 (m, 2H), 2. 0 3-2. 0 7 (m, 2H), 2. 5 8 (b r s, 2H), 3. 0 8 (d, 2H), 4. 0 6-4. 2 0 (m, 4H), 4. 6 2 (s, 1H), 6. 6 0 (d, 1H), 7. 0 1 (d, 1H), 7. 1 1 (s, 1H), 7. 2 0 (d, 1H), 7. 6 2 (d d, 1H), 8. 3 9 (s, 1H)

化合物番号 5-1 7 6

δ 1. 5 5-1. 6 3 (m, 2H), 2. 0 2-2. 0 4 (m, 2H), 2. 5 5-2. 6 2 (m, 4H), 3. 0 8 (d, 2H), 4. 0 7 (t, 2H), 4. 1 5 (d d, 2H), 4. 6 3 (s, 1H), 5. 1 6 (d d, 2H), 5. 8 4-5. 9 7 (m, 1H), 6. 6 0 (d, 1H), 7. 0 1 (d, 1H), 7. 1 2 (s, 1H), 7. 1 8 (d, 1H), 7. 6 2 (d d, 1H), 8. 3 9 (s, 1H)

化合物番号 5-1 3 9

δ 1. 5 3-1. 6 3 (m, 2H), 1. 7 6 (d, 6H), 2. 0 2-2. 0 7 (m, 2H), 2. 5 8 (b r s, 2H), 3. 0 8 (d, 2H), 4. 1 6 (d d, 2H),

4. 57 (d, 2H), 4. 62 (s, 1H), 5. 46 (t, 1H), 6. 60 (d, 1H), 7. 01 (d, 1H), 7. 13 (s, 1H), 7. 18 (d, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 39 (s, 1H)

化合物番号5-123

$\delta$  1. 60-1. 67 (m, 2H), 2. 00-2. 09 (m, 2H), 2. 29 (br s, 1H), 2. 60 (br s, 2H), 3. 11 (d, 2H), 3. 94 (br s, 2H), 4. 08-4. 22 (m, 4H), 4. 62 (s, 1H), 6. 61 (d, 1H), 7. 04 (d, 1H), 7. 19 (s, 1H), 7. 20-7. 30 (m, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 39 (s, 1H)

【0224】

化合物番号5-147

$\delta$  1. 58-1. 65 (m, 2H), 2. 04-2. 06 (m, 2H), 2. 58 (br s, 2H), 3. 10 (d, 2H), 3. 84 (t, 2H), 4. 16-4. 30 (m, 4H), 4. 67 (s, 1H), 6. 61 (d, 1H), 7. 05 (d, 1H), 7. 16 (s, 1H), 7. 24-7. 26 (m, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 40 (s, 1H)

化合物番号5-124

$\delta$  1. 57-1. 69 (m, 2H), 2. 02-2. 05 (m, 2H), 2. 57 (br s, 2H), 3. 09 (d, 2H), 3. 43 (s, 3H), 3. 77 (t, 2H), 4. 13-4. 20 (m, 4H), 4. 65 (s, 1H), 6. 60 (d, 1H), 7. 02 (d, 1H), 7. 16 (s, 1H), 7. 17-7. 25 (m, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 39 (s, 1H)

化合物番号5-132

$\delta$  1. 57-1. 66 (m, 2H), 2. 00-2. 06 (m, 2H), 2. 59 (br s, 2H), 3. 11 (d, 2H), 3. 79 (s, 3H), 4. 12-4. 22 (m, 2H), 4. 65-4. 69 (m, 3H), 6. 60 (d, 1H), 7. 05 (d, 1H), 7. 13 (s, 1H), 7. 21-7. 28 (m, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 39 (s, 1H)

化合物5-134

$\delta$  1. 58-1. 64 (m, 2H), 1. 95-2. 13 (m, 2H), 2. 06 (s, 3H), 2. 58 (br s, 2H), 3. 09 (d, 2H), 4. 16-4. 25 (m, 4H), 4. 44 (t, 2H), 4. 63 (s, 1H), 6. 61 (d, 1H), 7. 04 (d, 1H), 7. 16 (s, 1H), 7. 22-7. 29 (m, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 39 (s, 1H)

化合物番号5-133

$\delta$  1. 31 (t, 3H), 1. 59-1. 65 (m, 2H), 2. 04-2. 07 (m, 2H), 2. 60 (br s, 2H), 3. 10 (d, 2H), 4. 14-4. 30 (m, 4H), 4. 68 (s, 3H), 6. 61 (d, 1H), 7. 05 (d, 1H), 7. 13 (s, 1H), 7. 25-7. 28 (m, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 39 (s, 1H)

【0225】

化合物番号5-163

$\delta$  1. 15 (t, 3H), 1. 62-1. 69 (m, 2H), 1. 99-2. 12 (m, 4H), 2. 64 (br s, 2H), 3. 14 (d, 2H), 3. 32 (t, 2H), 4. 23 (dd, 2H), 4. 64 (s, 1H), 6. 62 (d, 1H), 7. 14 (d, 1H), 7. 53 (d, 1H), 7. 54 (s, 1H), 7. 64 (dd, 1H), 8. 41 (s, 1H)

化合物5-126

$\delta$  1. 63-1. 68 (m, 2H), 1. 93-2. 04 (m, 2H), 2. 35 (s, 3H), 2. 61 (br s, 2H), 3. 12 (d, 2H), 4. 21 (dd, 2H),

4. 58 (s, 2H), 4. 66 (s, 1H), 6. 62 (d, 1H), 7. 05 (s-like, 2H), 7. 26 (s-like, 1H), 7. 63 (dd, 1H), 8. 40 (s, 1H)

化合物 5-127

$\delta$  1. 27 (d, 3H), 1. 59-1. 67 (m, 2H), 2. 00-2. 04 (m, 2H), 2. 61 (brs, 3H), 3. 12 (d, 2H), 3. 81 (t, 1H), 4. 04 (dd, 1H), 4. 08-4. 22 (m, 3H), 4. 62 (s, 1H), 6. 61 (d, 1H), 7. 03 (d, 1H), 7. 12 (s, 1H), 7. 20 (s-like, 1H), 7. 63 (dd, 1H), 8. 40 (s, 1H)

化合物 5-128

$\delta$  1. 28 (d, 3H), 1. 57-1. 64 (m, 2H), 2. 01-2. 04 (m, 2H), 2. 58 (brs, 2H), 3. 09 (d, 2H), 3. 46 (s, 3H), 3. 69-3. 80 (m, 1H), 3. 91-4. 04 (m, 1H), 4. 18 (brd, 2H), 4. 64 (s, 1H), 6. 61 (d, 1H), 7. 01 (d, 1H), 7. 12 (s, 1H), 7. 16 (d, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 39 (s, 1H)

【0226】

化合物 5-129

$\delta$  1. 28 (s, 6H), 1. 56-1. 67 (m, 2H), 1. 99-2. 04 (m, 2H), 2. 46 (s, 1H), 2. 60 (brs, 2H), 3. 11 (d, 2H), 3. 85 (s, 2H), 4. 20 (dd, 2H), 4. 62 (s, 1H), 6. 62 (d, 1H), 7. 02 (d, 1H), 7. 14 (s, 1H), 7. 18 (s-like, 1H), 7. 63 (dd, 1H), 8. 40 (s, 1H)

化合物 5-130

$\delta$  1. 33 (s, 6H), 1. 58-1. 64 (m, 2H), 2. 02-2. 05 (m, 2H), 2. 58 (brs, 2H), 3. 10 (d, 2H), 3. 31 (s, 3H), 3. 87 (s, 2H), 4. 18 (dd, 2H), 4. 65 (s, 1H), 6. 61 (d, 1H), 7. 01 (d, 1H), 7. 13 (s, 1H), 7. 18 (d, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 40 (s, 1H)

化合物 5-114

$\delta$  1. 37 (d, 3H), 1. 57-1. 64 (m, 2H), 1. 77-1. 90 (m, 1H), 2. 03-2. 05 (m, 2H), 2. 04 (s, 3H), 2. 57 (brs, 2H), 3. 09 (d, 2H), 3. 57 (t, 1H), 4. 03-4. 20 (m, 2H), 4. 62 (s, 1H), 5. 25-5. 35 (m, 1H), 6. 61 (d, 1H), 7. 02 (d, 1H), 7. 13 (s, 1H), 7. 22 (d, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 39 (s, 1H)

化合物 5-138

$\delta$  1. 58-1. 70 (m plus d, 5H), 2. 02-2. 05 (m, 2H), 2. 58 (brs, 2H), 3. 10 (d, 2H), 4. 03-4. 21 (m, 4H), 4. 28-4. 38 (m, 1H), 4. 66 (s, 1H), 6. 61 (d, 1H), 7. 04 (d, 1H), 7. 13 (s, 1H), 7. 17 (d, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 40 (s, 1H)

【0227】

化合物 5-98

$\delta$  1. 06 (t, 3H), 1. 80-1. 92 (m, 2H), 2. 01-2. 04 (m, 4H), 2. 57 (brs, 2H), 2. 93 (d, 2H), 3. 97 (t, 2H), 4. 18 (dd, 2H), 4. 57 (s, 1H), 6. 85 (d, 1H), 7. 01 (d, 1H), 7. 11 (s, 1H), 7. 17 (d, 1H), 7. 35 (dd, 1H), 8. 40 (s, 1H)

化合物 5-202

$\delta$  1.41 (t, 1H), 1.59–1.66 (m, 2H), 1.77 (t, 1H), 2.05–2.22 (m, 3H), 2.60 (br s, 2H), 3.11 (dd, 2H), 4.05 (t, 1H), 4.19 (dd, 2H), 4.29 (dd, 1H), 4.66 (s, 1H), 6.61 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.23 (d-like, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物 6–82

$\delta$  0.92 (t, 3H), 1.42–1.47 (m, 1H), 1.57–1.80 (m, 5H), 1.98–2.04 (m, 2H), 2.35 (br s, 2H), 3.55 (dd, 2H), 3.93 (t, 2H), 4.08 (d, 2H), 4.48 (t, 1H), 6.62 (d, 1H), 6.99 (d, 1H), 7.09 (s, 1H), 7.12 (d, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.42 (s, 1H)

化合物 7–103

$\delta$  0.35–0.40 (m, 2H), 0.61–0.67 (m, 2H), 1.24–1.36 (m, 1H), 1.45–1.51 (m, 1H), 1.57–1.63 (m, 2H), 1.67–1.88 (m, 1H), 2.18–2.31 (m, 4H), 3.25 (d, 2H), 3.91 (d, 2H), 4.46 (d, 2H), 4.62 (s, 1H), 6.66 (d, 1H), 7.02 (d, 1H), 7.12 (s, 1H), 7.18 (d, 1H), 7.63 (dd, 1H), 8.42 (s, 1H)

化合物 2–130

$\delta$  1.31 (d, 3H), 2.00–2.22 (m, 6H), 2.40–2.50 (m, 2H), 3.45 (s, 3H), 3.72–3.81 (m, 1H), 3.88–3.93 (m, 1H), 4.01–4.06 (m, 1H), 4.56–4.61 (m+br s, 3H), 6.56 (d, 1H), 6.77 (d, 1H), 7.10 (s, 1H), 7.17 (d, 1H), 7.61 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物 1–98

$\delta$  1.05 (t, 3H), 1.13 (d, 3H), 1.71–1.91 (m, 4H), 2.05–2.15 (m, 2H), 3.00 (dd, 1H), 3.22–3.30 (m, 1H), 3.93 (t, 2H), 4.10–4.24 (m, 2H), 6.67 (d, 1H), 6.98 (d, 1H), 7.10 (d, 1H), 7.16 (d, 1H), 7.61 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物 5–118

$\delta$  0.36 (q, 2H), 0.63 (q, 2H), 1.19–1.31 (m, 1H), 1.55–1.63 (m, 2H), 2.07 (br t, 2H), 2.57 (br s, 2H), 3.07 (d, 2H), 3.87 (d, 2H), 4.17 (dd, 2H), 4.63 (s, 1H), 6.59 (d+q, 2H), 6.99–7.03 (m, 3H), 7.61 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物 6–4

$\delta$  1.40–1.56 (m, 1H), 1.75–1.86 (m, 3H), 1.91–2.05 (m, 2H), 2.61 (br s, 2H), 3.40 (dd, 2H), 4.16 (d, 2H), 4.56 (t, 1H), 5.81 (s, 1H), 6.62 (d, 1H), 6.91 (d, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.19 (s, 1H), 7.63 (dd, 1H), 8.42 (s, 1H)

化合物 2–90

$\delta$  1.08 (t, 3H), 1.81–1.93 (m, 2H), 1.97–2.09 (m, 4H), 2.16–2.24 (m, 2H), 2.40–2.46 (m, 2H), 2.98 (s, 3H), 3.97 (t, 2H), 4.48 (br s, 2H), 4.59 (t, 1H), 6.57 (d, 1H), 6.77 (d, 1H), 7.07 (s, 1H), 7.14 (d, 1H), 7.51 (dd, 1H), 8.07 (s, 1H)

化合物 2–167

$\delta$  0.98 (t, 3H), 1.42 (t, 3H), 1.67–1.75 (m, 2H), 2

. 01—2. 23 (m, 6H), 2. 42 (d, 2H), 2. 87—2. 97 (m, 2H), 4. 28—4. 35 (m, 2H), 4. 57 (b r s, 2H), 4. 62 (t, 1H), 6. 56 (d, 1H), 6. 84 (d, 1H), 7. 39 (d, 1H), 7. 62 (d d, 1H), 7. 70 (s, 1H), 8. 41 (s, 1H)

【0228】

化合物1—95

δ 1. 02—1. 16 (m, 8H), 1. 26 (s, 3H), 1. 79—1. 94 (m, 4H), 3. 30 (m, 1H), 3. 80 (d, 1H), 3. 90—3. 99 (m, 2H), 4. 08 (q, 2H), 4. 13—4. 38 (m, 2H), 4. 77 (b r s, 1H), 6. 71 (d, 1H), 7. 06 (s, 1H), 7. 09 (d, 1H), 7. 16 (d, 1H), 7. 60 (d d, 1H), 8. 37 (s, 1H)

化合物5—93

δ 1. 06 (t, 3H), 1. 63—1. 69 (m, 2H), 1. 74—1. 88 (m, 2H), 2. 00—2. 02 (m, 2H), 2. 55 (b r s, 2H), 3. 01 (d, 2H), 4. 00 (t, 2H), 4. 07—4. 16 (m, 2H), 4. 38 (s, 2H), 4. 59 (s, 1H), 6. 59 (d, 1H), 7. 01 (d, 1H), 7. 10 (s, 1H), 7. 13 (d, 1H), 7. 50 (d d, 1H), 8. 12 (s, 1H)

化合物2—81

δ 1. 09 (t, 3H), 1. 84—2. 21 (m, 8H), 2. 40—2. 43 (m, 2H), 3. 97 (t, 2H), 4. 56—4. 62 (b r m, 3H), 6. 56 (d, 1H), 6. 73 (d, 1H), 7. 08 (s, 1H), 7. 23 (m, 1H), 7. 62 (d d, 1H), 8. 41 (s, 1H)

化合物2—67

δ 2. 00—2. 21 (m, 4H), 2. 28—2. 35 (m, 4H), 4. 59 (b r s, 2H), 4. 66 (t, 1H), 6. 58 (d, 1H), 6. 88 (d, 1H), 7. 63 (d d, 1H), 7. 74 (d, 1H), 7. 86 (s, 1H), 8. 41 (s, 1H)

化合物5—99

δ 1. 06 (t, 3H), 1. 58—1. 63 (m, 2H), 1. 65—1. 89 (m, 2H), 2. 02—2. 04 (m, 2H), 2. 57 (b r s, 2H), 3. 06 (d, 2H), 4. 00 (t, 2H), 4. 16 (d, 2H), 4. 62 (s, 1H), 6. 57 (t, 1H), 6. 63 (d, 1H), 7. 01 (d, 1H), 7. 11 (s, 1H), 7. 17 (d, 1H), 7. 60 (d d, 1H), 8. 24 (s, 1H)

【0229】

化合物5—103

δ 1. 04 (t, 3H), 1. 57—1. 64 (m, 2H), 1. 77—1. 88 (m, 2H), 1. 96—2. 04 (m, 2H), 2. 58 (b r s, 2H), 3. 13 (d, 2H), 3. 91 (t, 2H), 4. 17 (d, 2H), 4. 52 (s, 1H), 6. 61 (d, 1H), 6. 63 (d, 1H), 6. 75 (s—l i k e, 2H), 7. 63 (d d, 1H), 8. 40 (s, 1H)

化合物5—101

δ 1. 06 (t, 3H), 1. 47—1. 67 (m, 3H), 1. 79—1. 91 (m, 2H), 2. 01—2. 04 (m, 2H), 2. 56 (b r s, 2H), 3. 03 (d, 2H), 3. 97 (t, 2H), 4. 09 (d d, 2H), 4. 57 (b r s, 2H), 4. 60 (s, 1H), 6. 61 (d, 1H), 7. 01 (d, 1H), 7. 11 (s, 1H), 7. 17 (d, 1H), 7. 52 (d d, 1H), 8. 14 (s, 1H)

化合物5—4

δ 1. 69 (m, 2H), 1. 97 (m, 2H), 2. 65 (b s, 2H), 3. 14 (d, 2H), 4. 24 (d d, 2H), 4. 65 (s, 1H), 5. 65 (s, 1H), 6. 63 (d, 1H), 6. 99 (d, 1H), 7. 14 (d, 1H), 7. 20 (s,



1 H), 7.65 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物5-177

δ 1.62 (m, 2H), 2.04 (m, 2H), 2.53 (s, 1H), 2.60 (bs, 2H), 3.10 (d, 2H), 4.19 (dd, 2H), 4.63 (s, 1H), 4.77 (s, 2H), 6.61 (d, 1H), 7.04 (d, 1H), 7.27 (m, 2H), 7.62 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物5-75

δ 1.63 (m, 2H), 1.98 (m, 2H), 2.61 (bs, 2H), 3.15 (d, 2H), 3.37 (d, 1H), 3.68 (d, 1H), 4.20 (dd, 2H), 4.61 (s, 1H), 5.07 (d, 2H), 5.93 (m, 1H), 6.63 (d, 1H), 6.97 (d, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

【0230】

化合物5-69

δ 1.65 (m, 2H), 1.94 (m, 2H), 2.61 (bs, 2H), 3.15 (d, 2H), 3.43 (s, 3H), 4.21 (dd, 2H), 4.63 (m, 3H), 4.77 (s, 2H), 6.62 (d, 1H), 7.00 (d, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.70 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物5-131

δ 1.35 (s, 6H), 1.58 (m, 2H), 2.02 (m, 2H), 2.55 (bs, 2H), 3.07 (d, 2H), 3.68 (s, 3H), 4.02 (s, 2H), 4.15 (dd, 2H), 4.58 (s, 1H), 6.61 (d, 1H), 6.99 (d, 1H), 7.10 (s, 1H), 7.19 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物5-137

δ 1.62 (m, 2H), 2.03 (m, 2H), 2.36 (s, 6H), 2.58 (bs, 2H), 2.77 (t, 2H), 3.09 (d, 2H), 4.14 (m, 4H), 4.63 (s, 1H), 6.60 (d, 1H), 7.00 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物5-136

δ 1.65 (m, 2H), 2.00 (m, 5H), 2.60 (bs, 2H), 3.11 (d, 2H), 3.67 (q, 2H), 4.10 (t, 2H), 4.21 (dd, 2H), 4.62 (s, 1H), 5.94 (bs, 1H), 6.62 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.23 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物5-73

δ 1.41 (d, 3H), 1.65 (d, 2H), 1.97 (m, 2H), 2.62 (bs, 1H), 3.15 (d, 2H), 3.37 (s, 3H), 4.20 (m, 2H), 4.62 (m, 3H), 5.08 (q, 1H), 6.63 (d, 1H), 6.97 (d, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.73 (s, 1H), 8.40 (s, 1H)

【0231】

製剤実施例

(殺虫・殺ダニ剤)

次に、本発明の組成物の実施例を若干示すが、添加物及び添加割合は、これら実施例に限定されるべきものではなく、広範囲に変化させることが可能である。製剤実施例中の部は重量部を示す。

【0232】

製剤実施例1

水和剤

本発明化合物

40部



珪藻土 5 3 部

高級アルコール硫酸エステル 4 部

アルキルナフタレンスルホン酸塩 3 部

以上を均一に混合して微細に粉砕して、有効成分 4 0 % の水和剤を得た。

【 0 2 3 3 】

製剤実施例 2 乳剤

本発明化合物 3 0 部

キシレン 3 3 部

ジメチルホルムアミド 3 0 部

ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル  
7 部

以上を混合溶解して、有効成分 3 0 % の乳剤を得た。

【 0 2 3 4 】

製剤実施例 3 粉剤

本発明化合物 1 0 部

タルク 8 9 部

ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル  
1 部

以上を均一に混合して微細に粉砕して、有効成分 1 0 % の粉剤を得た。

【 0 2 3 5 】

製剤実施例 4 粒剤

本発明化合物 5 部

クレー 7 3 部

ベントナイト 2 0 部

ジオクチルスルホサキシネートナトリウム塩  
1 部

リン酸ナトリウム 1 部

以上をよく粉砕混合し、水を加えてよく練り合せた後、造粒乾燥して有効成分 5 % の粒剤を得た。

【 0 2 3 6 】

製剤実施例 5 懸濁剤

本発明化合物 1 0 部

リグニンスルホン酸ナトリウム 4 部

ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム 1 部

キサントガム 0 . 2 部

水 8 4 . 8 部

以上を混合し、粒度が 1 ミクロン以下になるまで湿式粉砕し、有効成分 1 0 % の懸濁液を得た。

次に、本発明化合物が各種殺ダニ剤の有効成分として有用であることを試験例で示す。

【 0 2 3 7 】

試験例 1 ナミハダニに対する効力

3 寸鉢に播種したインゲンの発芽後 7 ~ 1 0 日を経過した第 1 本葉上に、有機リン剤抵抗性のナミハダニ雌成虫を 1 7 頭接種したのち、前記薬剤の実施例 1 に示された水和剤の処方に従い、化合物濃度が 1 2 5 p p m になるように水で希釈した薬液を散布した。温度 2 5 ° C 、湿度 6 5 % の恒温室内に置き、3 日後に殺成虫率を調査した。試験は 2 反復である。その結果以下の化合物が 1 0 0 % の殺虫率を示した。

1 - 8 、 1 - 9 、 1 - 1 0 、 1 - 1 3 、 1 - 1 5 、 1 - 1 6 、 1 - 1 7 、 1 - 1 8 、 1 - 1 9 、 1 - 2 2 、 1 - 2 3 、 1 - 2 7 、 1 - 2 9 、 1 - 4 4 、 1 - 4 5 、 1 - 4 6 、 1 - 4 7 、 1 - 4 8 、 1 - 4 9 、 1 - 5 4 、 1 - 5 7 、 1 - 5 9 、 1 - 6 3 、 1 - 6 6 、 1 - 6 7 、 1 - 6 9 、 1 - 7 1 、 1 - 7 2 、 1 - 7 3 、 1 - 7 4 、 1 - 7 5 、 1 - 7 6 、 1 -

79、1-80、1-81、1-82、1-88、1-89、1-90、1-91、1-92、1-93、1-94、1-97、1-98、1-100、1-101、1-102、1-105、1-108、1-114、1-115、1-117、1-118、1-133、1-136、1-139、1-140、1-142、1-143、1-147、1-150、1-153、1-163、1-172、1-173、1-174、1-179、2-13、2-51、2-54、2-57、2-58、2-59、2-60、2-62、2-77、2-78、2-81、2-82、2-83、2-84、2-85、2-86、2-89、2-93、2-95、2-96、2-97、2-98、2-100、2-102、2-105、2-111、2-112、2-115、2-130、2-138、2-141、2-143、2-144、2-145、2-147、2-148、2-150、2-151、2-152、2-155、2-157、2-159、2-160、2-161、2-165、2-166、5-22、5-32、5-38、5-69、5-70、5-72、5-73、5-75、5-89、5-90、5-96、5-97、5-98、5-99、5-100、5-102、5-104、5-105、5-106、5-110、5-111、5-114、5-116、5-118、5-120、5-121、5-124、5-125、5-126、5-127、5-128、5-129、5-130、5-134、5-138、5-139、5-147、5-149、5-161、5-162、5-163、5-164、5-174、5-175、5-176、5-177、5-182、5-183、5-184、5-190、5-191、5-198、5-199、5-200、7-82、7-100、7-103、8-63

#### 【0238】

##### 試験例2 ミカンハダニに対する効力

シャーレに入れたミカン葉上に、殺ダニ剤抵抗性のミカンハダニの雌成虫を10頭接種したのち、前記薬剤の実施例2に示された乳剤の処方に従い、化合物濃度が31ppmになるように水で希釈した薬液を回転散布塔にて散布した。温度25℃、湿度65%の恒温室内に置き、散布3日後に、成虫を除去し、この3日間に産付された卵に関し、成虫まで発育し得たか否かを11日目に調査した。その結果以下の化合物が100%の殺虫率を示した。

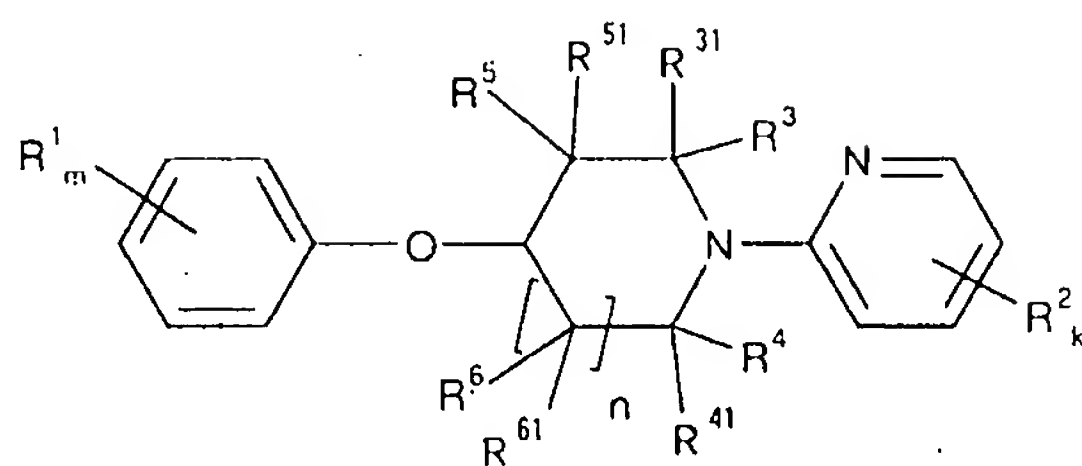
1-13、1-15、1-22、1-27、1-45、1-54、1-59、1-63、1-66、1-69、1-71、1-72、1-75、1-80、1-88、1-89、1-92、1-93、1-94、1-97、1-98、1-100、1-102、1-105、1-108、1-133、1-136、1-142、1-153、2-54、2-57、2-58、2-59、2-60、2-78、2-81、2-82、2-84、2-97、2-98、2-105、2-130、2-141、2-147、5-22、5-69、5-70、5-72、5-73、5-90、5-96、5-97、5-105、5-110、5-111、5-116、5-118、5-120、5-121、5-124、5-149、5-162、5-174、5-175、5-177、5-190、7-82、7-100、7-103

【書類名】 要約書

【課題】 本発明は、有害生物防除剤となりうる新規化合物を提供することを課題とする。

【解決手段】 一般式〔 1 〕

【化 1 〕



〔 1 〕

〔式中、R<sup>1</sup>は、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル基等、R<sup>2</sup>は、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル基等、R<sup>3</sup>、R<sup>31</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>41</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>51</sup>、R<sup>6</sup>、およびR<sup>61</sup>はそれぞれ独立して、水素原子、またはC<sub>1-6</sub>アルキル基等、またはR<sup>3</sup>とR<sup>4</sup>またはR<sup>5</sup>とR<sup>6</sup>とが一緒になって飽和環を形成し、全体として橋かけ環を形成してもよい。〕

で表される化合物およびその塩の1種または2種以上を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤。

【選択図】 なし

出願人履歴

0 0 0 0 0 4 3 0 7

19900822

新規登録

東京都千代田区大手町 2 丁目 2 番 1 号

日本曹達株式会社